

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成28年1月28日(2016.1.28)

【公表番号】特表2015-501845(P2015-501845A)

【公表日】平成27年1月19日(2015.1.19)

【年通号数】公開・登録公報2015-004

【出願番号】特願2014-547462(P2014-547462)

【国際特許分類】

C 07 J 63/00 (2006.01)  
C 07 C 225/14 (2006.01)  
A 61 K 31/56 (2006.01)  
A 61 K 9/14 (2006.01)  
A 61 K 9/20 (2006.01)  
A 61 K 9/12 (2006.01)  
A 61 P 31/18 (2006.01)  
A 61 K 45/00 (2006.01)

【F I】

C 07 J 63/00  
C 07 C 225/14 C S P  
A 61 K 31/56  
A 61 K 9/14  
A 61 K 9/20  
A 61 K 9/12  
A 61 P 31/18  
A 61 K 45/00

【手続補正書】

【提出日】平成27年12月4日(2015.12.4)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

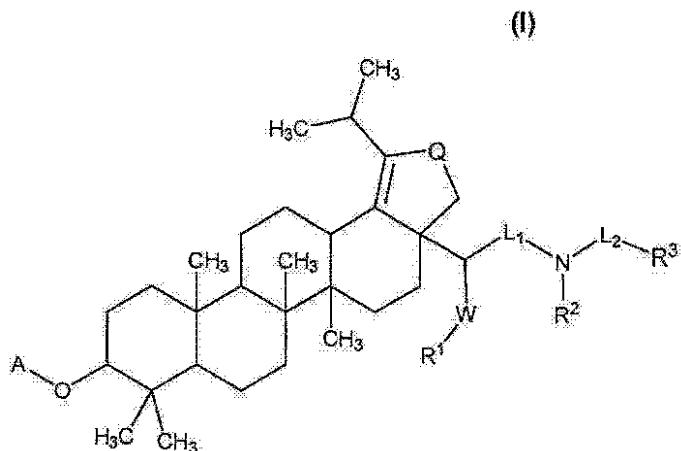
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記式1の構造を有する化合物または該化合物の製薬上許容される塩。

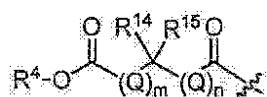
## 【化1】



[式中、

Aは

## 【化2】



であり；

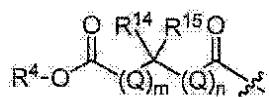
$\text{L}_1$ および $\text{L}_2$ は独立に、結合または $[\text{C}(\text{R}^6\text{R}^6)]_q$ から選択され；

Qの各場合は独立に、 $-\text{CH}_2-$ または $-\text{C}(=\text{O})-$ から選択され；

Wは、結合またはOから選択され；

$\text{R}^1$ は、 $-\text{H}$ 、 $(\text{C}_1-\text{C}_{12})$ アルキル、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^5$ 、 $-\text{CH}_2-\text{O}- (\text{C}_1-\text{C}_6)$ アルキル、2-テトラヒドロ-2H-ピランおよび

## 【化3】



からなる群から選択され；

$\text{R}^2$ は、 $-\text{H}$ 、 $(\text{C}_1-\text{C}_{12})$ アルキル、 $-(\text{C}_1-\text{C}_6)$ アルキル- $\text{OR}^4$ 、 $-(\text{C}_1-\text{C}_6)$ アルキル- $\text{O}-(\text{C}_1-\text{C}_6)$ アルキル、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^5$ 、 $-(\text{CH}_2)_r\text{NR}^7\text{R}^8$ 、および $-(\text{CH}_2)_r\text{N}^+(\text{R}^4)_3$ からなる群から選択され、WがOである場合、 $\text{R}^1$ および $\text{R}^2$ がそれらがそれぞれ結合しているOおよびNと一体となって4から8員の複素環を形成していても良く、前記複素環は1から2個の $\text{R}^{11}$ 基によって置換されても良く；

$\text{R}^3$ は、水素、 $(\text{C}_1-\text{C}_{12})$ アルキル、 $-\text{NR}^1\text{R}^2$ 、 $-\text{OR}^5$ 、

## 【化4】



からなる群から選択され、

Xは単環式もしくは二環式の $(\text{C}_5-\text{C}_{14})$ アリールであり、

Yは、単環式もしくは二環式の $(\text{C}_2-\text{C}_9)$ 複素環または単環式もしくは二環式の $(\text{C}_2-\text{C}_9)$ ヘテロアリールから選択され、それらはそれぞれS、NまたはOから選択される1から3個の

ヘテロ原子を有しており、

Zは単環式もしくは二環式の(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)シクロアルキルであり；

R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>がそれらがそれぞれ結合している窒素とともに、4から8員の複素環を形成しても良く、前記複素環は1から2個のR<sup>11</sup>基によって置換されても良く；

R<sup>4</sup>は、-Hおよび(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルからなる群から選択され；

R<sup>5</sup>は、-H、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、-R<sup>3</sup>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>および-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>OR<sup>7</sup>からなる群から選択され；

R<sup>6</sup>およびR<sup>6</sup>は独立に、-H、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)シクロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ、ハロアルキル、-Y、-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-C(O)OHおよび-C(O)NH<sub>2</sub>からなる群から選択され、前記R<sup>6</sup>およびR<sup>6</sup>基がそれらが結合している炭素とともに、3から8員のシクロアルキル環を形成しても良く、前記シクロアルキル環は1から3個のR<sup>11</sup>基によって置換されても良く；

R<sup>7</sup>およびR<sup>8</sup>は独立に、-H、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)シクロアルキル、-Q-アリール-(R<sup>4</sup>)<sub>n</sub>、-NR<sup>14</sup>R<sup>15</sup>、-C(O)CH<sub>3</sub>からなる群から選択され、R<sup>7</sup>およびR<sup>8</sup>がそれらが結合している窒素とともに、-NR<sup>5</sup>-、-O-、-S-、-S(O)-もしくは-SO<sub>2</sub>-から選択される1から3個のヘテロ原子を含む4から8員の複素環またはヘテロアリール環を形成しても良く、前記複素環またはヘテロアリール環は1から3個のR<sup>11</sup>基によって置換されても良く；

R<sup>9</sup>はハロであり；

R<sup>10</sup>は-N(R<sup>16</sup>)<sub>2</sub>であり；

R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>およびR<sup>13</sup>は独立に、オキソ、ヒドロキシリル、ハロ、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ、-R<sup>6</sup>(R<sup>9</sup>)<sub>q</sub>、-OR<sup>6</sup>(R<sup>9</sup>)<sub>q</sub>、ニトロ、-SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、-C(O)R<sup>10</sup>、-R<sup>4</sup>YR<sup>6</sup>、-CO(O)R<sup>4</sup>、および-CO(O)R<sup>5</sup>からなる群から選択され、いずれか2個のR<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>またはR<sup>13</sup>基が一体となって3から8員のシクロアルキル、アリール、複素環またはヘテロアリール環を形成しても良く、前記複素環またはヘテロアリール環は-NR<sup>5</sup>-、-O-、-S-、-S(O)-もしくは-SO<sub>2</sub>-から選択される1から3個のヘテロ原子を含むことができ、前記シクロアルキル、アリール、複素環またはヘテロアリール環は1から3個のR<sup>16</sup>基によって置換されても良く；

R<sup>14</sup>およびR<sup>15</sup>は独立に、-H、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)シクロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ、-[C(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>]<sub>r</sub>-、-O[C(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>]<sub>r</sub>-、オキソ、ヒドロキシリル、ハロ、-C(O)R<sup>7</sup>、-R<sup>10</sup>および-CO(O)R<sup>2</sup>からなる群から選択され、R<sup>14</sup>およびR<sup>15</sup>がそれらが結合している炭素とともに、-NR<sup>5</sup>-、-O-、-S-、-S(O)-もしくは-SO<sub>2</sub>-から選択される1から3個のヘテロ原子を含む3から8員のシクロアルキル環または4から8員の複素環を形成しても良く、前記シクロアルキル環または複素環は1から3個のR<sup>16</sup>基によって置換されても良く；

R<sup>16</sup>は独立に、-H、ハロ、オキソ、ヒドロキシリル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ、(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)シクロアルキル、-R<sup>6</sup>(R<sup>9</sup>)<sub>q</sub>、-OR<sup>6</sup>(R<sup>9</sup>)<sub>q</sub>、-N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>-複素環、-C(O)OH、-C(O)NH<sub>2</sub>、-R<sup>5</sup>(R<sup>9</sup>)<sub>q</sub>、-OR<sup>5</sup>(R<sup>9</sup>)<sub>q</sub>、ニトロ、-SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、-C(O)R<sup>10</sup>および-CO(O)R<sup>4</sup>からなる群から選択され；

mおよびnは各場合で、独立に0、1、2、3または4であり；

pは独立に0、1、2、3または4であり；

rおよびqは各場合で独立に0、1、2、3または4である。】

#### 【請求項2】

L<sub>1</sub>およびL<sub>2</sub>がいずれも[C(R<sup>6</sup>R<sup>6</sup>)]<sub>q</sub>である請求項1に記載の化合物。

#### 【請求項3】

L<sub>1</sub>およびL<sub>2</sub>がいずれも-CH<sub>2</sub>-である請求項1に記載の化合物。

#### 【請求項4】

qの各場合が独立に、1、2または3である請求項1に記載の化合物。

#### 【請求項5】

qが1である請求項1に記載の化合物。

#### 【請求項6】

Wが0である請求項1に記載の化合物。

#### 【請求項7】

Wが結合である請求項1に記載の化合物。

【請求項8】

Wが結合である場合、R<sup>1</sup>が-Hである請求項1に記載の化合物。

【請求項9】

Wが0である場合、R<sup>1</sup>が-Hである請求項1に記載の化合物。

【請求項10】

前記A基におけるQ<sub>m</sub>が非存在であり、前記A基におけるQ<sub>n</sub>が-CH<sub>2</sub>-であり、前記式Iの構造におけるQが-C(=O)-である請求項1に記載の化合物。

【請求項11】

R<sup>1</sup>が-Hである請求項1に記載の化合物。

【請求項12】

R<sup>2</sup>が-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>である請求項1に記載の化合物。

【請求項13】

R<sup>2</sup>が(ジメチルアミノ)エチルである請求項1に記載の化合物。

【請求項14】

rの各場合が独立に0、1、2または3である請求項1に記載の化合物。

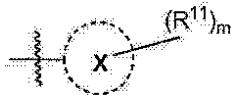
【請求項15】

rが2である請求項1に記載の化合物。

【請求項16】

R<sup>3</sup>が

【化5】



である請求項1に記載の化合物。

【請求項17】

Xが単環式(C<sub>5</sub>-C<sub>14</sub>)アリールである請求項1に記載の化合物。

【請求項18】

Xがフェニルである請求項1に記載の化合物。

【請求項19】

R<sup>4</sup>が-Hである請求項1に記載の化合物。

【請求項20】

mの各場合が独立に0または1である請求項1に記載の化合物。

【請求項21】

mが0である請求項1に記載の化合物。

【請求項22】

mが1である請求項1に記載の化合物。

【請求項23】

nが1である請求項1に記載の化合物。

【請求項24】

R<sup>6</sup>およびR<sup>6</sup>がいずれも-Hである請求項1に記載の化合物。

【請求項25】

R<sup>7</sup>およびR<sup>8</sup>がいずれも(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルである請求項1に記載の化合物。

【請求項26】

R<sup>7</sup>がメチルである請求項1に記載の化合物。

【請求項27】

R<sup>8</sup>がメチルである請求項1に記載の化合物。

【請求項28】

R<sup>7</sup>およびR<sup>8</sup>がいずれもメチルである請求項1に記載の化合物。

## 【請求項 2 9】

$R^{11}$ がハロである請求項1に記載の化合物。

## 【請求項 3 0】

$R^{11}$ がクロロ、ブロモまたはフルオロから選択される請求項1に記載の化合物。

## 【請求項 3 1】

$R^{11}$ がクロロである請求項1に記載の化合物。

## 【請求項 3 2】

$R^{11}$ が非存在である請求項に記載の化合物。

## 【請求項 3 3】

$R^{14}$ および $R^{15}$ がいずれも( $C_1-C_6$ )アルキルである請求項1に記載の化合物。

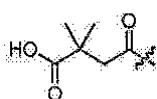
## 【請求項 3 4】

$R^{14}$ および $R^{15}$ がいずれもメチルである請求項1に記載の化合物。

## 【請求項 3 5】

Aが

## 【化 6】



である請求項1に記載の化合物。

## 【請求項 3 6】

Aが

## 【化 7】

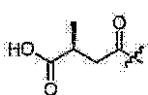


である請求項1に記載の化合物。

## 【請求項 3 7】

Aが

## 【化 8】

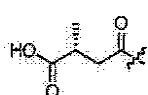


である請求項1に記載の化合物。

## 【請求項 3 8】

Aが

## 【化 9】



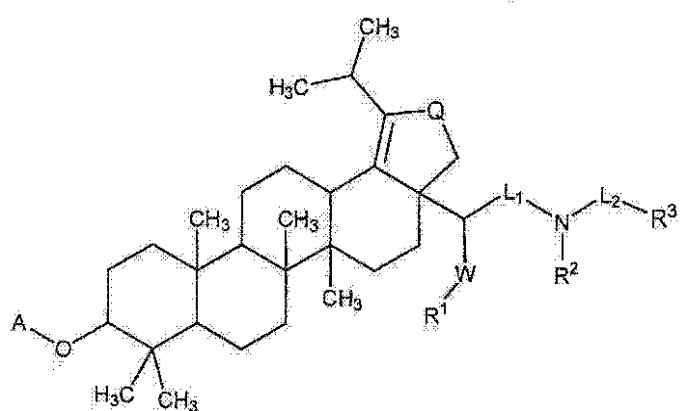
である請求項1に記載の化合物。

## 【請求項 3 9】

下記式Iの構造を有する化合物または該化合物の製薬上許容される塩。

## 【化10】

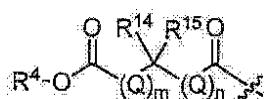
(I)



[式中、

Aは

## 【化11】



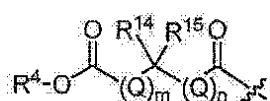
であり；

 $L_1$  および  $L_2$  は  $[C(R^6R^6)]_q$  であり；各 Q は独立に、 $-CH_2-$  または  $-C(=O)-$  から選択され；

W は、結合または O から選択され；

 $R^1$  は、H、 $(C_1-C_6)$  アルキル、 $-C(O)R^4$  および

## 【化12】



からなる群から選択され；

 $R^2$  は、H、 $(C_1-C_6)$  アルキル、 $-(C_1-C_6)$  アルキル- $OR^4$ 、 $-(C_1-C_6)$  アルキル- $O-(C_1-C_6)$  アルキル、 $-C(O)R^5$ 、および  $-(CH_2)_rNR^7R^8$ 、および  $-(CH_2)_rN^+(R^4)_3$  からなる群から選択され； $R^3$  は、H、 $(C_1-C_{12})$  アルキル、 $-NR^1R^2$ 、 $-OR^5$ 、

## 【化13】



からなる群から選択され、

X は单環式もしくは二環式の  $(C_5-C_{14})$  アリールであり、Y は、单環式もしくは二環式の  $(C_2-C_9)$  複素環または单環式もしくは二環式の  $(C_2-C_9)$  ヘテロアリールから選択され、それらはそれぞれ S、N または O から選択される 1 から 3 個のヘテロ原子を有しております、Z は单環式もしくは二環式の  $(C_3-C_8)$  シクロアルキルであり； $R^4$  は、H および  $(C_1-C_6)$  アルキルからなる群から選択され；

$R^5$ は、 $(C_1-C_6)$ アルキル、 $-(CH_2)_rNR^7R^8$ および $-(CH_2)_rOR^7$ からなる群から選択され； $R^6$ および $R^6'$ は独立に、-H、 $(C_1-C_6)$ アルキル、 $(C_3-C_8)$ シクロアルキル、 $(C_1-C_6)$ アルコキシ、ハロアルキル、 $-(CH_2)_rNR^7R^8$ 、-C(O)OHおよび-C(O)NH<sub>2</sub>からなる群から選択され、前記 $R^6$ および $R^6'$ 基がそれらが結合している炭素とともに、3から8員のシクロアルキル環を形成しても良く、前記シクロアルキル環は1から3個の $R^{11}$ 基によって置換されていても良く；

$R^7$ および $R^8$ は独立に、-H、 $(C_1-C_6)$ アルキル、 $(C_3-C_8)$ シクロアルキル、 $NR^{14}R^{15}$ および-C(O)CH<sub>3</sub>からなる群から選択され；

$R^9$ はハロであり；

$R^{10}$ は $-N(R^{16})_2$ であり；

$R^{11}$ 、 $R^{12}$ および $R^{13}$ は独立に、オキソ、ヒドロキシル、ハロ、 $(C_1-C_6)$ アルコキシ、-R<sup>6</sup>( $R^9$ )<sub>q</sub>、-OR<sup>6</sup>( $R^9$ )<sub>q</sub>、ニトロ、-SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、 $(C_1-C_6)$ アルキル、-C(O)R<sup>10</sup>、-R<sup>4</sup>YR<sup>6</sup>、-CO(O)R<sup>4</sup>、および-CO(O)R<sup>5</sup>からなる群から選択され；

$R^{14}$ および $R^{15}$ は独立に、-H、 $(C_1-C_6)$ アルキル、 $(C_3-C_8)$ シクロアルキル、 $(C_1-C_6)$ アルコキシ、-[C(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>]<sub>r</sub>、-O[C(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>]<sub>r</sub>、オキソ、ヒドロキシル、ハロ、-C(O)R<sup>7</sup>、-R<sup>10</sup>および-CO(O)R<sup>2</sup>からなる群から選択され；

$R^{16}$ は独立に、-H、オキソ、ハロ、ヒドロキシル、 $(C_1-C_6)$ アルキル、 $(C_1-C_6)$ アルコキシ、 $(C_3-C_8)$ シクロアルキル、-R<sup>6</sup>( $R^9$ )<sub>q</sub>、-OR<sup>6</sup>( $R^9$ )<sub>q</sub>、-N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、 $-(CH_2)_r$ -複素環、-C(O)OH、-C(O)NH<sub>2</sub>、-R<sup>5</sup>( $R^9$ )<sub>q</sub>、-OR<sup>5</sup>( $R^9$ )<sub>q</sub>、ニトロ、-SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、-C(O)R<sup>10</sup>、および-CO(O)R<sup>4</sup>からなる群から選択され；

mおよびnは各場合で、独立に0、1、2、3または4であり；

pは独立に0、1、2、3または4であり；

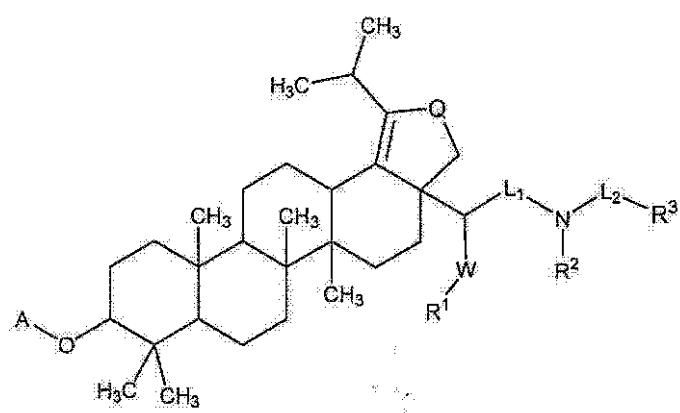
rおよびqは各場合で独立に0、1、2、3または4である。】

#### 【請求項 4 0】

下記式Iの構造を有する化合物または該化合物の製薬上許容される塩。

#### 【化 1 4】

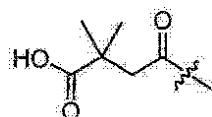
(I)



[ 式中、

Aは、

#### 【化 1 5】



であり；

L<sub>1</sub>およびL<sub>2</sub>はいずれも(-CH<sub>2</sub>-)であり；

Qは-C(=O)-であり；

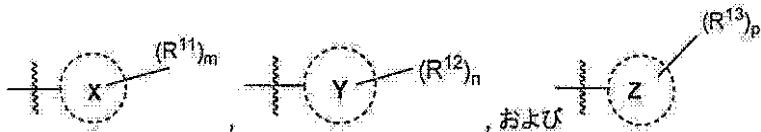
WはOであり；

R<sup>1</sup>は-Hであり；

R<sup>2</sup>は、-H、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル-OR<sup>4</sup>、-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル-O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、-C(O)R<sup>5</sup>および-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>からなる群から選択され；

R<sup>3</sup>は、-H、(C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)アルキル、-NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、-OR<sup>5</sup>、

【化16】



からなる群から選択され；

Xは単環式もしくは二環式の(C<sub>5</sub>-C<sub>14</sub>)アリールであり、

Yは、単環式もしくは二環式の(C<sub>2</sub>-C<sub>9</sub>)複素環または単環式もしくは二環式の(C<sub>2</sub>-C<sub>9</sub>)ヘテロアリールから選択され、それらはそれぞれS、NまたはOから選択される1から3個のヘテロ原子を有しており、

Zは単環式もしくは二環式の(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)シクロアルキルであり；

R<sup>4</sup>は、-Hおよび(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルからなる群から選択され；

R<sup>5</sup>は、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>および-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>OR<sup>7</sup>からなる群から選択され；

R<sup>6</sup>およびR<sup>6</sup>は独立に、-H、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)シクロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ、ハロアルキル、-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-C(O)OHおよび-C(O)NH<sub>2</sub>からなる群から選択され；

R<sup>7</sup>およびR<sup>8</sup>は独立に、-H、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)シクロアルキル、-NR<sup>14</sup>R<sup>15</sup>および-C(O)CH<sub>3</sub>からなる群から選択され；

R<sup>9</sup>はハロであり；

R<sup>10</sup>は-N(R<sup>16</sup>)<sub>2</sub>であり；

R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>およびR<sup>13</sup>は独立に、オキソ、ヒドロキシリル、ハロ、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ、-R<sup>6</sup>(R<sup>9</sup>)<sub>q</sub>、-OR<sup>6</sup>(R<sup>9</sup>)<sub>q</sub>、ニトロ、-SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、-C(O)R<sup>10</sup>、-R<sup>4</sup>YR<sup>6</sup>、-CO(O)R<sup>4</sup>および-CO(O)R<sup>5</sup>からなる群から選択され；

R<sup>14</sup>およびR<sup>15</sup>は独立に、-H、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)シクロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ、-[C(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>]<sub>r</sub>、-O[C(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>]<sub>r</sub>、オキソ、ヒドロキシリル、ハロ、-C(O)R<sup>7</sup>、-R<sup>10</sup>および-CO(O)R<sup>2</sup>からなる群から選択され；

R<sup>16</sup>は独立に、-H、オキソ、ハロ、ヒドロキシリル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ、(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)シクロアルキル、-R<sup>6</sup>(R<sup>9</sup>)<sub>q</sub>、-OR<sup>6</sup>(R<sup>9</sup>)<sub>q</sub>、-N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>複素環、-C(O)OH、-C(O)NH<sub>2</sub>、-R<sup>5</sup>(R<sup>9</sup>)<sub>q</sub>、-OR<sup>5</sup>(R<sup>9</sup>)<sub>q</sub>、ニトロ、-SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、-C(O)R<sup>10</sup>および-CO(O)R<sup>4</sup>からなる群から選択され；

各場合でmおよびnは独立に0、1または2であり；

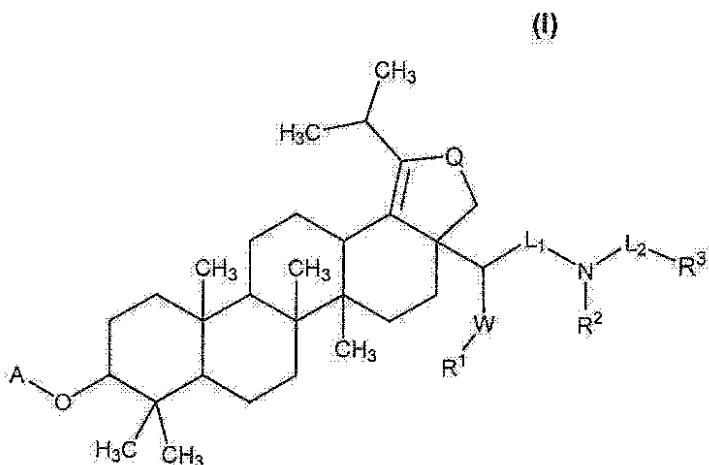
pは独立に0、1または2であり；

各場合でrおよびqは独立に0、1、2または3である。】

【請求項41】

下記式Iの構造を有する化合物または該化合物の製薬上許容される塩。

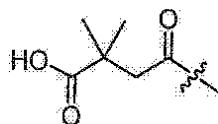
## 【化17】



[式中、

Aは

## 【化18】



であり；

$L_1$  および  $L_2$  はいずれも  $(-\text{CH}_2-)$  であり；

Qは  $-\text{C}(=\text{O})-$  であり；

WはOであり；

$R^1$ は-Hであり；

$R^2$ は、-H、 $(\text{C}_1\text{-}\text{C}_6)$ アルキル、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^5$ および $-(\text{CH}_2)_n\text{NR}^7\text{R}^8$ からなる群から選択され；

$R^3$ は

## 【化19】



であり、Xは单環式もしくは二環式の $(\text{C}_5\text{-}\text{C}_{14})$ アリールであり；

$R^4$ は、-Hおよび $(\text{C}_1\text{-}\text{C}_6)$ アルキルからなる群から選択され；

$R^5$ は、 $(\text{C}_1\text{-}\text{C}_6)$ アルキル、 $-(\text{CH}_2)_n\text{NR}^7\text{R}^8$ および $-(\text{CH}_2)_n\text{OR}^7$ からなる群から選択され；

$R^6$ は、-H、 $(\text{C}_1\text{-}\text{C}_6)$ アルキル、 $(\text{C}_3\text{-}\text{C}_8)$ シクロアルキル、 $(\text{C}_1\text{-}\text{C}_6)$ アルコキシ、ハロアルキル、 $-(\text{CH}_2)_n\text{NR}^7\text{R}^8$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OH}$ および $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ からなる群から選択され；

$R^7$ および $R^8$ は独立に、-H、 $(\text{C}_1\text{-}\text{C}_6)$ アルキル、 $(\text{C}_3\text{-}\text{C}_8)$ シクロアルキル、 $-\text{NR}^{14}\text{R}^{15}$ および $-\text{C}(\text{O})\text{CH}_3$ からなる群から選択され；

$R^9$ はハロであり；

$R^{10}$ は $-\text{N}(\text{R}^{16})_2$ であり；

$R^{11}$ 、 $R^{12}$ および $R^{13}$ は独立に、オキソ、ヒドロキシリル、ハロ、 $(\text{C}_1\text{-}\text{C}_6)$ アルコキシ、 $-\text{R}^6(\text{R}^9)_q$ 、 $-\text{OR}^6(\text{R}^9)_q$ 、ニトロ、 $-\text{SO}_2\text{R}^6$ 、 $(\text{C}_1\text{-}\text{C}_6)$ アルキル、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{10}$ 、 $-\text{CO}(\text{O})\text{R}^4$ および $-\text{CO}(\text{O})\text{R}^5$ からなる群から選択され；

$R^{14}$ および $R^{15}$ は独立に、-H、 $(\text{C}_1\text{-}\text{C}_6)$ アルキル、 $(\text{C}_3\text{-}\text{C}_8)$ シクロアルキル、 $(\text{C}_1\text{-}\text{C}_6)$ アルコキシ、 $-[\text{C}(\text{R}^6)_2]_{r-}$ 、 $-\text{O}[\text{C}(\text{R}^6)_2]_{r-}$ 、オキソ、ヒドロキシリル、ハロ、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^7$ 、 $-\text{R}^{10}$ および $-\text{CO}(\text{O})\text{R}^2$ からなる群から選択され；

$R^{16}$ は独立に、-H、オキソ、ハロ、ヒドロキシル、 $(C_1-C_6)$ アルキル、 $(C_1-C_6)$ アルコキシ、 $(C_3-C_8)$ シクロアルキル、 $-R^6(R^9)_q$ 、 $-OR^6(R^9)_q$ 、 $-N(R^4)_2$ 、 $-(CH_2)_r$ 複素環、 $-C(O)OH$ 、 $-C(O)NH_2$ 、 $-R^5(R^9)_q$ 、 $-OR^5(R^9)_q$ 、ニトロ、 $-SO_2R^6$ 、 $-C(O)R^{10}$ および $-CO(O)R^4$ からなる群から選択され；

各場合でmおよびnは独立に0、1または2であり；

pは独立に0、1または2であり；

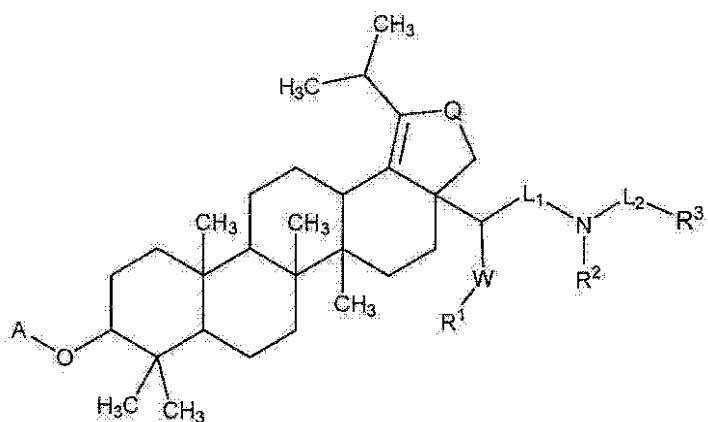
各場合でrおよびqは独立に0、1、2または3である。]

#### 【請求項 4 2】

下記式Iの構造を有する化合物または該化合物の製薬上許容される塩。

#### 【化 2 0】

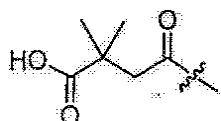
(I)



[式中、

Aは

#### 【化 2 1】



であり；

$L_1$ および $L_2$ はいずれも $(-CH_2-)$ であり；

Qは $-C(=O)-$ であり；

WはOであり；

$R^1$ は-Hであり；

$R^2$ は $-(CH_2)_rNR^7R^8$ であり；

$R^3$ は

#### 【化 2 2】



であり、Xはフェニルであり；

$R^7$ および $R^8$ は独立に、-Hおよびメチルからなる群から選択され；

$R^9$ は、クロロ、ブロモおよびフルオロからなる群から選択され；

$R^{11}$ は、クロロ、ブロモおよびフルオロからなる群から選択され；

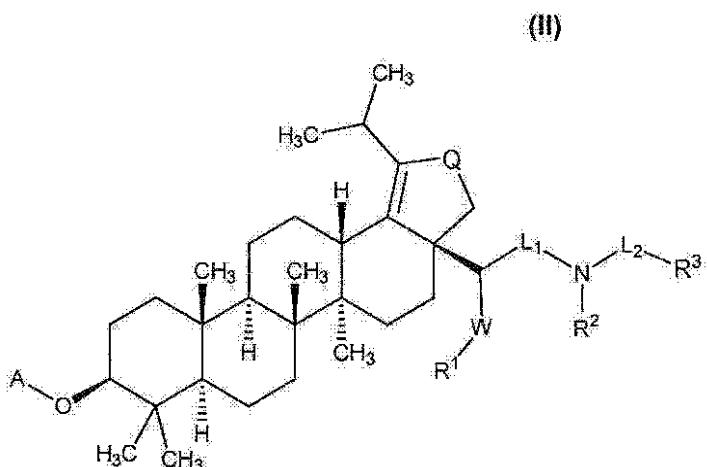
mは独立に0、1または2であり；

rは独立に1、2または3である。]

## 【請求項 4 3】

下記式(I)の構造を有する化合物または該化合物の製薬上許容される塩。

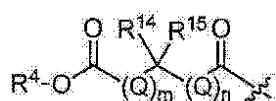
## 【化 2 3】



[ 式中、

Aは

## 【化 2 4】



であり；

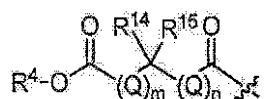
$\text{L}_1$  および  $\text{L}_2$  は独立に、結合または  $[\text{C}(\text{R}^6\text{R}^6)]_q$  から選択され；

Qの各場合は独立に、-CH<sub>2</sub>- または -C(=O)- から選択され；

Wは、結合またはOから選択され；

R<sup>1</sup>は、-H、(C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)アルキル、-C(O)R<sup>5</sup>、-CH<sub>2</sub>-O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、2-テトラヒドロ-2H-ピランおよび

## 【化 2 5】



からなる群から選択され；

R<sup>2</sup>は、-H、(C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)アルキル、-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル-OR<sup>4</sup>、-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル-O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、-C(O)R<sup>5</sup>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>および-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>N<sup>+</sup>(R<sup>4</sup>)<sub>3</sub>からなる群から選択され、WがOである場合、R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>がそれらがそれぞれ結合しているOおよびNと一体となって、4から8員の複素環を形成していても良く、前記複素環は1から2個のR<sup>11</sup>基によって置換されても良く；

R<sup>3</sup>は、-H、(C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)アルキル、-NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、-OR<sup>5</sup>、

## 【化 2 6】



からなる群から選択され、

Xは単環式もしくは二環式の( $C_5-C_{14}$ )アリールであり、

Yは、単環式もしくは二環式の( $C_2-C_9$ )複素環または単環式もしくは二環式の( $C_2-C_9$ )ヘテロアリールから選択され、それらはそれぞれS、NまたはOから選択される1から3個のヘテロ原子を有しており、

Zは単環式もしくは二環式の( $C_3-C_8$ )シクロアルキルであり；

$R^2$ および $R^3$ がそれらがそれらが結合している窒素および $L_2$ と一体となって、4から8員の複素環を形成しても良く、前記複素環は1から2個の $R^{11}$ 基によって置換されても良く；

$R^4$ は、-Hおよび( $C_1-C_6$ )アルキルからなる群から選択され；

$R^5$ は、-H、( $C_1-C_6$ )アルキル、- $R^3$ 、-( $CH_2$ )<sub>r</sub> $NR^7R^8$ および-( $CH_2$ )<sub>r</sub> $OR^7$ からなる群から選択され；

$R^6$ および $R^6$ は独立に、-H、( $C_1-C_6$ )アルキル、( $C_3-C_8$ )シクロアルキル、( $C_1-C_6$ )アルコキシ、ハロアルキル、-Y、-( $CH_2$ )<sub>r</sub> $NR^7R^8$ 、-C(O)OHおよび-C(O)NH<sub>2</sub>からなる群から選択され、前記 $R^6$ および $R^6$ 基がそれらが結合している炭素とともに、3から8員のシクロアルキル環を形成しても良く、前記シクロアルキル環は1から3個の $R^{11}$ 基によって置換されても良く；

$R^7$ および $R^8$ は独立に、-H、( $C_1-C_6$ )アルキル、( $C_3-C_8$ )シクロアルキル、-Q-アリール-( $R^4$ )<sub>n</sub>、- $NR^{14}R^{15}$ 、-C(O)CH<sub>3</sub>からなる群から選択され、 $R^7$ および $R^8$ がそれらが結合している窒素とともに、- $NR^5$ -、-O-、-S-、-S(O)-もしくは-SO<sub>2</sub>-から選択される1から3個のヘテロ原子を含む4から8員の複素環またはヘテロアリール環を形成しても良く、前記複素環またはヘテロアリール環は1から3個の $R^{11}$ 基によって置換されても良く；

$R^9$ はハロであり；

$R^{10}$ は- $N(R^{16})_2$ であり；

$R^{11}$ 、 $R^{12}$ および $R^{13}$ は独立に、オキソ、ヒドロキシリル、ハロ、( $C_1-C_6$ )アルコキシ、- $R^6$ ( $R^9$ )<sub>q</sub>、- $OR^6(R^9)_q$ 、ニトロ、-SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、( $C_1-C_6$ )アルキル、-C(O)R<sup>10</sup>、-R<sup>4</sup>YR<sup>6</sup>、-CO(O)R<sup>4</sup>および-CO(O)R<sup>5</sup>からなる群から選択され、いずれか2個の $R^{11}$ 、 $R^{12}$ または $R^{13}$ 基が一体となって、3から8員のシクロアルキル、アリール、複素環またはヘテロアリール環を形成しても良く、前記複素環またはヘテロアリール環は-NR<sup>5</sup>-、-O-、-S-、-S(O)-または-SO<sub>2</sub>-から選択される1から3個のヘテロ原子を含んでいても良く、前記シクロアルキル、アリール、複素環またはヘテロアリール環は1から3個の $R^{16}$ 基によって置換されても良く；

$R^{14}$ および $R^{15}$ は独立に、-H、( $C_1-C_6$ )アルキル、( $C_3-C_8$ )シクロアルキル、( $C_1-C_6$ )アルコキシ、-[C( $R^6$ )<sub>2</sub>]<sub>r</sub>-、-O[C( $R^6$ )<sub>2</sub>]<sub>r</sub>-、オキソ、ヒドロキシリル、ハロ、-C(O)R<sup>7</sup>、-R<sup>10</sup>および-CO(O)R<sup>2</sup>からなる群から選択され、 $R^{14}$ および $R^{15}$ がそれらが結合している炭素とともに、- $NR^5$ -、-O-、-S-、-S(O)-または-SO<sub>2</sub>-から選択される1から3個のヘテロ原子を含む3から8員のシクロアルキル環または4から8員の複素環を形成しても良く、前記シクロアルキル環または複素環は1から3個の $R^{16}$ 基によって置換されても良く；

$R^{16}$ は独立に、-H、ハロ、オキソ、ヒドロキシリル、( $C_1-C_6$ )アルキル、( $C_1-C_6$ )アルコキシ、( $C_3-C_8$ )シクロアルキル、-R<sup>6</sup>( $R^9$ )<sub>q</sub>、-OR<sup>6</sup>( $R^9$ )<sub>q</sub>、-N( $R^4$ )<sub>2</sub>、-( $CH_2$ )<sub>r</sub>-複素環、-C(O)OH、-C(O)NH<sub>2</sub>、-R<sup>5</sup>( $R^9$ )<sub>q</sub>、-OR<sup>5</sup>( $R^9$ )<sub>q</sub>、ニトロ、-SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、-C(O)R<sup>10</sup>および-CO(O)R<sup>4</sup>からなる群から選択され；

各場合でmおよびnは独立に0、1、2、3または4であり；

pは独立に0、1、2、3または4であり；

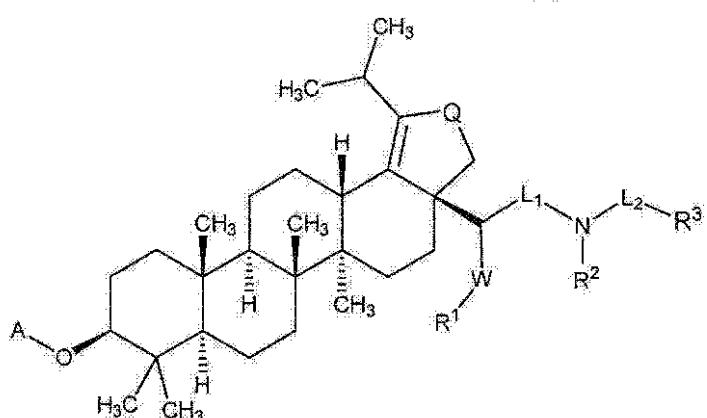
各場合でrおよびqは独立に0、1、2、3または4である。】

#### 【請求項 4 4】

下記式(II)の構造を有する化合物または該化合物の製薬上許容される塩。

【化27】

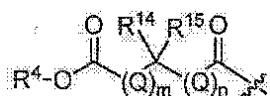
(II)



[式中、

Aは、

【化28】



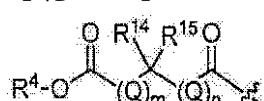
であり；

 $\text{L}_1$  および  $\text{L}_2$  は  $[\text{C}(\text{R}^6\text{R}^6)]_q$  であり；Qの各場合は独立に、-CH<sub>2</sub>-または-C(=O)-から選択され；

Wは、結合またはOから選択され；

R<sup>1</sup>は、-H、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、-C(O)R<sup>4</sup>、および

【化29】



からなる群から選択され；

R<sup>2</sup>は、-H、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル-OR<sup>4</sup>、-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル-O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、-C(O)R<sup>5</sup>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>および-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>N<sup>+(R<sup>4</sup>)<sub>3</sub>からなる群から選択され；</sup>R<sup>3</sup>は、-H、(C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)アルキル、-NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、-OR<sup>5</sup>、

【化30】



からなる群から選択され、

Xは単環式もしくは二環式の(C<sub>5</sub>-C<sub>14</sub>)アリールであり、Yは、単環式もしくは二環式の(C<sub>2</sub>-C<sub>9</sub>)複素環または単環式もしくは二環式の(C<sub>2</sub>-C<sub>9</sub>)ヘテロアリールから選択され、それらはそれぞれS、NまたはOから選択される1から3個のヘテロ原子を有しております、Zは単環式もしくは二環式の(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)シクロアルキルであり；R<sup>4</sup>は、-Hおよび(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルからなる群から選択され；

$R^5$ は、 $(C_1-C_6)$ アルキル、 $-(CH_2)_rNR^7R^8$ および $-(CH_2)_rOR^7$ からなる群から選択され； $R^6$ および $R^6$ は独立に、-H、 $(C_1-C_6)$ アルキル、 $(C_3-C_8)$ シクロアルキル、 $(C_1-C_6)$ アルコキシ、ハロアルキル、 $-(CH_2)_rNR^7R^8$ 、-C(O)OHおよび-C(O)NH<sub>2</sub>からなる群から選択され、前記 $R^6$ および $R^6$ 基がそれらが結合している炭素とともに、3から8員のシクロアルキル環を形成しても良く、前記シクロアルキル環は1から3個の $R^{11}$ 基によって置換されていても良く；

$R^7$ および $R^8$ は独立に、-H、 $(C_1-C_6)$ アルキル、 $(C_3-C_8)$ シクロアルキル、-NR<sup>14</sup>R<sup>15</sup>および-C(O)CH<sub>3</sub>からなる群から選択され；

$R^9$ はハロであり；

$R^{10}$ は-N(R<sup>16</sup>)<sub>2</sub>であり；

$R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、および $R^{13}$ は独立に、オキソ、ヒドロキシル、ハロ、 $(C_1-C_6)$ アルコキシ、-R<sup>6</sup>(R<sup>9</sup>)<sub>q</sub>、-OR<sup>6</sup>(R<sup>9</sup>)<sub>q</sub>、ニトロ、-SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、 $(C_1-C_6)$ アルキル、-C(O)R<sup>10</sup>、-R<sup>4</sup>YR<sup>6</sup>、-CO(O)R<sup>4</sup>および-CO(O)R<sup>5</sup>からなる群から選択され；

$R^{14}$ および $R^{15}$ は独立に、-H、 $(C_1-C_6)$ アルキル、 $(C_3-C_8)$ シクロアルキル、 $(C_1-C_6)$ アルコキシ、-[C(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>]<sub>r</sub>、-O[C(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>]<sub>r</sub>、オキソ、ヒドロキシル、ハロ、-C(O)R<sup>7</sup>、-R<sup>10</sup>および-CO(O)R<sup>2</sup>からなる群から選択され；

$R^{16}$ は独立に、-H、オキソ、ハロ、ヒドロキシル、 $(C_1-C_6)$ アルキル、 $(C_1-C_6)$ アルコキシ、 $(C_3-C_8)$ シクロアルキル、-R<sup>6</sup>(R<sup>9</sup>)<sub>q</sub>、-OR<sup>6</sup>(R<sup>9</sup>)<sub>q</sub>、-N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>-複素環、-C(O)OH、-C(O)NH<sub>2</sub>、-R<sup>5</sup>(R<sup>9</sup>)<sub>q</sub>、-OR<sup>5</sup>(R<sup>9</sup>)<sub>q</sub>、ニトロ、-SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、-C(O)R<sup>10</sup>および-CO(O)R<sup>4</sup>からなる群から選択され；

mおよびnは各場合で独立に、0、1、2、3または4であり；

pは独立に、0、1、2、3または4であり；

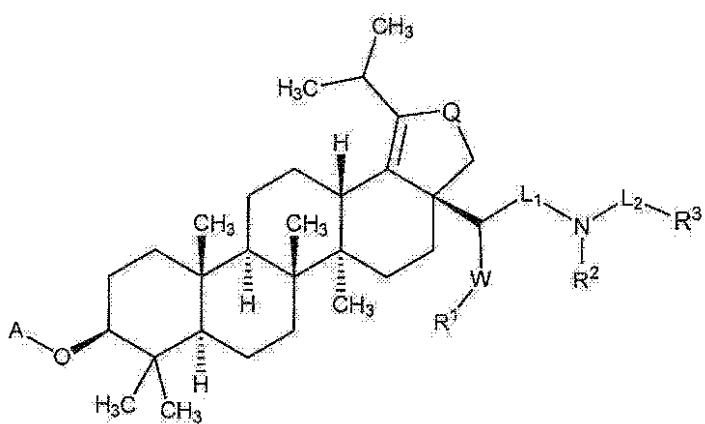
rおよびqは各場合で独立に、0、1、2、3または4である。】

#### 【請求項 4 5】

下記式(II)の構造を有する化合物または該化合物の製薬上許容される塩。

#### 【化 3 1】

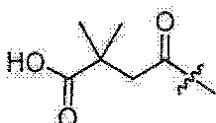
(II)



#### [式中

Aは、

#### 【化 3 2】



であり；

L<sub>1</sub>およびL<sub>2</sub>はいずれも(-CH<sub>2</sub>-)であり；

Qは-C(=O)-であり；

WはOであり；

R<sup>1</sup>は-Hであり；

R<sup>2</sup>は、-H、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、-C(O)R<sup>5</sup>および-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>からなる群から選択され；

R<sup>3</sup>は

【化33】



であり、Xは単環式もしくは二環式の(C<sub>5</sub>-C<sub>14</sub>)アリールであり；

R<sup>4</sup>は、-Hおよび(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルからなる群から選択され；

R<sup>5</sup>は、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、および-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>OR<sup>7</sup>からなる群から選択され；

R<sup>6</sup>は、-H、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)シクロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ、ハロアルキル、-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-C(O)OHおよび-C(O)NH<sub>2</sub>からなる群から選択され；

R<sup>7</sup>およびR<sup>8</sup>は独立に、-H、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)シクロアルキル、-NR<sup>14</sup>R<sup>15</sup>および-C(O)CH<sub>3</sub>からなる群から選択され；

R<sup>9</sup>はハロであり；

R<sup>10</sup>は-N(R<sup>16</sup>)<sub>2</sub>であり；

R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>およびR<sup>13</sup>は独立に、オキソ、ヒドロキシリル、ハロ、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ、-R<sup>6</sup>(R<sup>9</sup>)<sub>q</sub>、-OR<sup>6</sup>(R<sup>9</sup>)<sub>q</sub>、ニトロ、-SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、-C(O)R<sup>10</sup>、-CO(O)R<sup>4</sup>および-CO(O)R<sup>5</sup>からなる群から選択され；

R<sup>14</sup>およびR<sup>15</sup>は独立に、-H、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)シクロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ、-[C(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>]<sub>r</sub>、-O[C(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>]<sub>r</sub>、オキソ、ヒドロキシリル、ハロ、-C(O)R<sup>7</sup>、-R<sup>10</sup>および-CO(O)R<sup>2</sup>からなる群から選択され；

R<sup>16</sup>は独立に、-H、オキソ、ハロ、ヒドロキシリル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ、(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)シクロアルキル、-R<sup>6</sup>(R<sup>9</sup>)<sub>q</sub>、-OR<sup>6</sup>(R<sup>9</sup>)<sub>q</sub>、-N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>-複素環、-C(O)OH、-C(O)NH<sub>2</sub>、-R<sup>5</sup>(R<sup>9</sup>)<sub>q</sub>、-OR<sup>5</sup>(R<sup>9</sup>)<sub>q</sub>、ニトロ、-SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、-C(O)R<sup>10</sup>および-CO(O)R<sup>4</sup>からなる群から選択され；

mおよびnは各場合で独立に、0、1または2であり；

pは独立に、0、1または2であり；

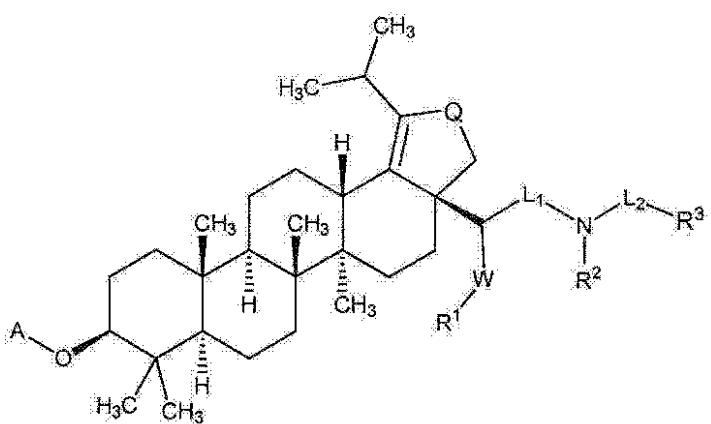
rおよびqは各場合で独立に、0、1、2または3である。】

【請求項46】

下記式(I)の構造を有する化合物または該化合物の製薬上許容される塩。

【化34】

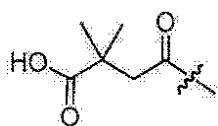
(I)



[式中、

Aは

【化35】



であり；

$L_1$ および $L_2$ はいずれも(-CH<sub>2</sub>-)であり；

Qは-C(=O)-であり；

WはOであり；

R<sup>1</sup>は-Hであり；

R<sup>2</sup>は-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>あり；

R<sup>3</sup>は

【化36】



であり、Xはフェニルであり；

R<sup>7</sup>およびR<sup>8</sup>は独立に、-Hおよびメチルからなる群から選択され；

R<sup>9</sup>は、クロロ、プロモおよびフルオロからなる群から選択され；

R<sup>11</sup>は、クロロ、プロモおよびフルオロからなる群から選択され；

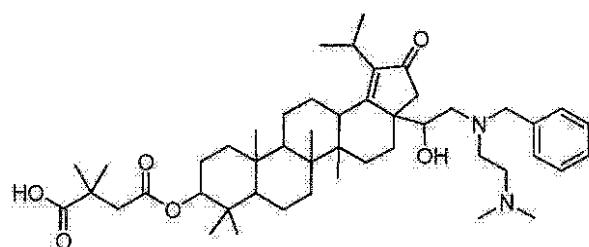
mは0、1または2であり；

rは1、2または3である。】

【請求項47】

下記構造を有する化合物または該化合物の製薬上許容される塩。

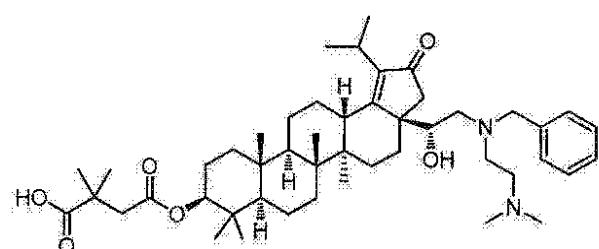
【化37】



【請求項48】

下記構造を有する化合物または該化合物の製薬上許容される塩。

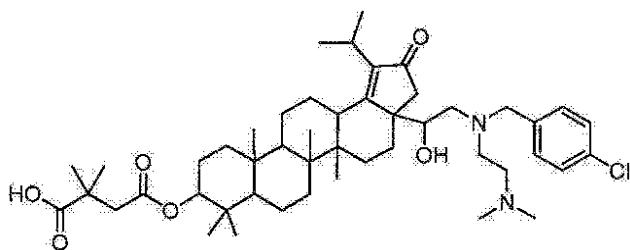
【化38】



【請求項49】

下記構造を有する化合物または該化合物の製薬上許容される塩。

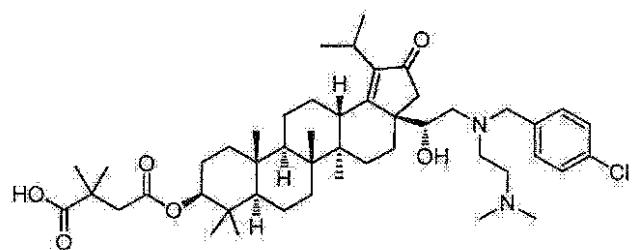
【化 3 9】



## 【請求項 50】

下記構造を有する化合物または該化合物の製薬上許容される塩。

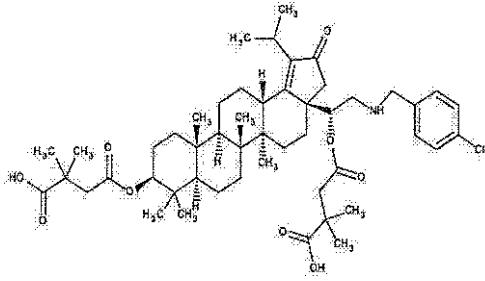
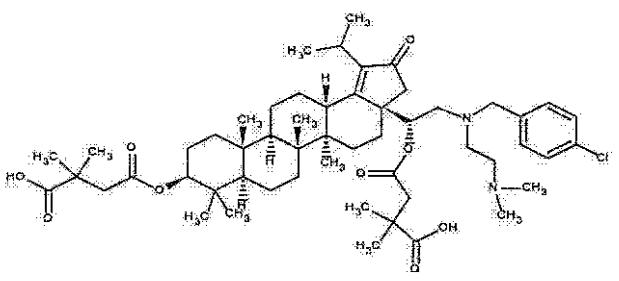
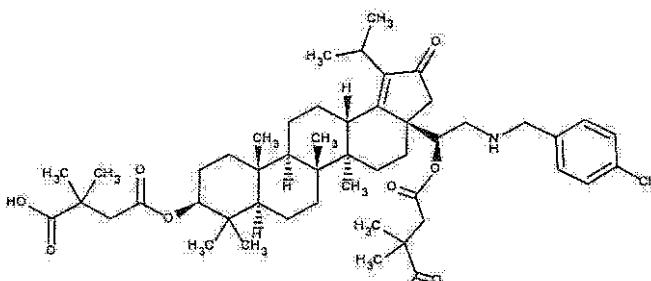
【化 4 0】

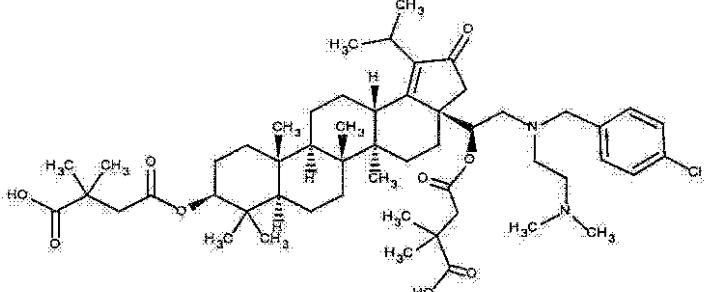
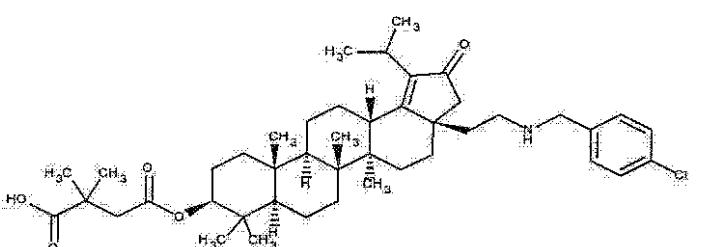
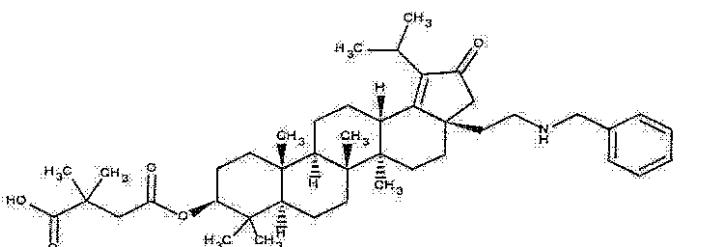
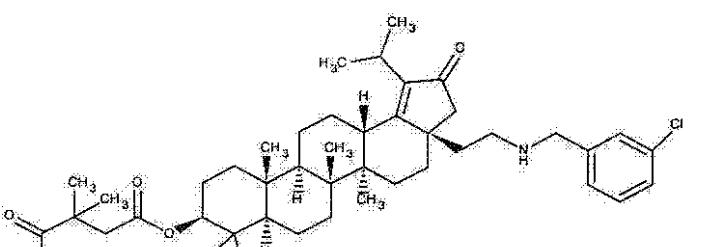


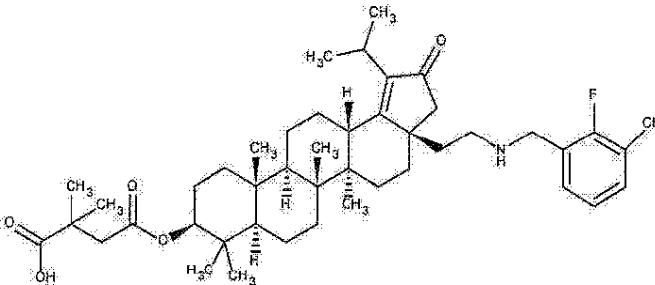
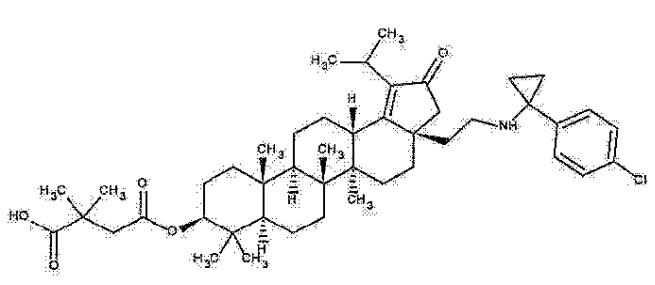
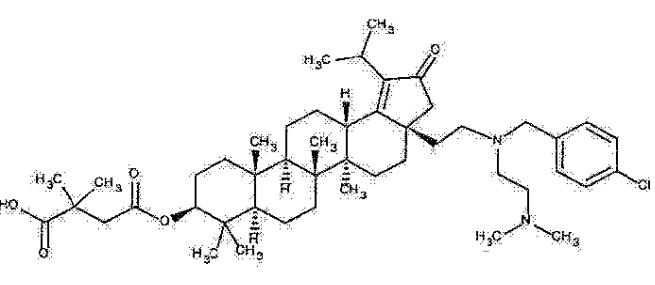
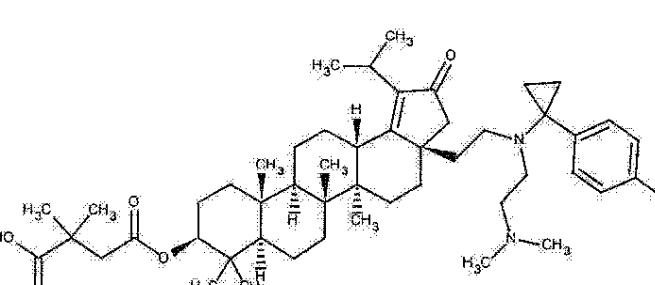
【請求項 5 1】

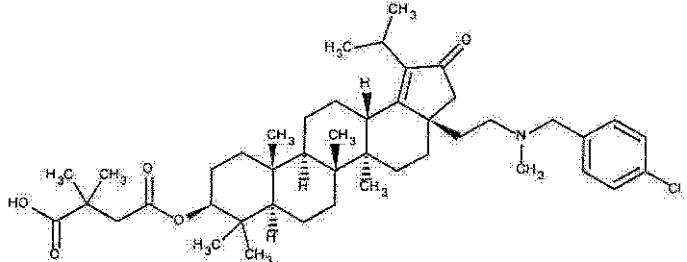
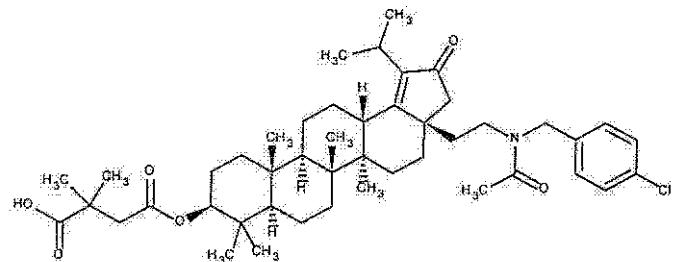
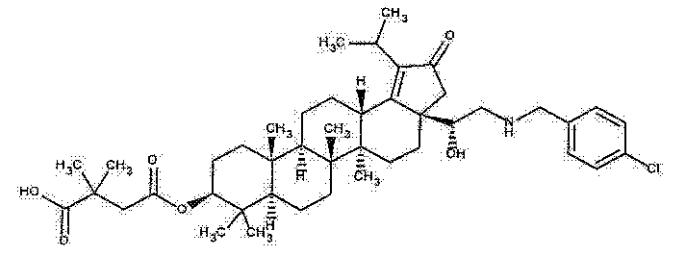
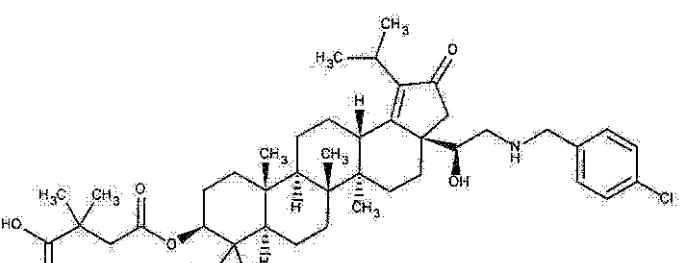
下記のものからなる群から選択される化合物または該化合物の製薬上許容される塩。

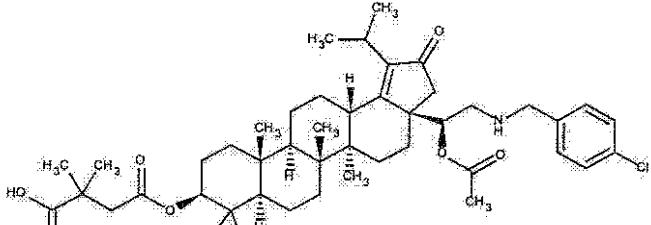
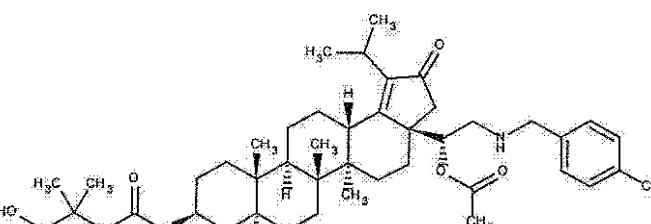
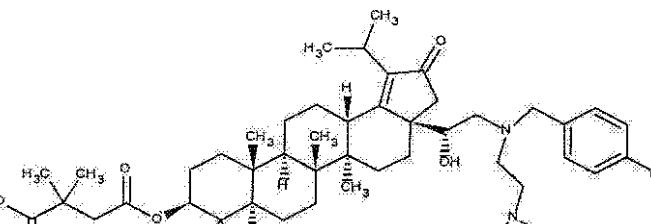
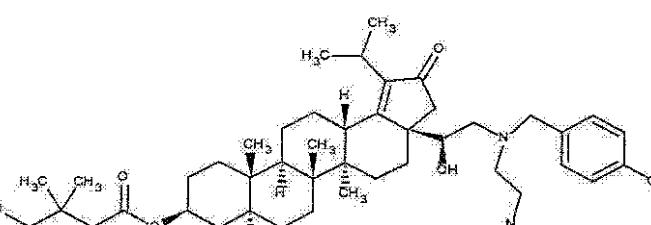
【表1】

親構造	化学名
	4-[(1R)-1-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R,17S,19R)-17-[(3-カルボキシ-3,3-ジメチルプロパノイル)オキシ]-1,2,14,18,18-ペンタメチル-7-オキソ-8-(プロパン-2-イル)ペンタシクロ[11.8.0.0^{(2,10),0^{(5,9),0^{(14,19)}}]ヘニコス-8-エン-5-イル]-2-[(4-クロロフェニル)メチル]アミノエトキシ]-2,2-ジメチル-4-オキソブタン酸
	4-[(1R)-1-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R,17S,19R)-17-[(3-カルボキシ-3,3-ジメチルプロパノイル)オキシ]-1,2,14,18,18-ペンタメチル-7-オキソ-8-(プロパン-2-イル)ペンタシクロ[11.8.0.0^{(2,10),0^{(5,9),0^{(14,19)}}]ヘニコス-8-エン-5-イル]-2-[(4-クロロフェニル)メチル]2-(ジメチルアミノ)エチル]アミノエトキシ]-2,2-ジメチル-4-オキソブタン酸
	4-[(1S)-1-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R,17S,19R)-17-[(3-カルボキシ-3,3-ジメチルプロパノイル)オキシ]-1,2,14,18,18-ペンタメチル-7-オキソ-8-(プロパン-2-イル)ペンタシクロ[11.8.0.0^{(2,10),0^{(5,9),0^{(14,19)}}]ヘニコス-8-エン-5-イル]-2-[(4-クロロフェニル)メチル]アミノエトキシ]-2,2-ジメチル-4-オキソブタン酸

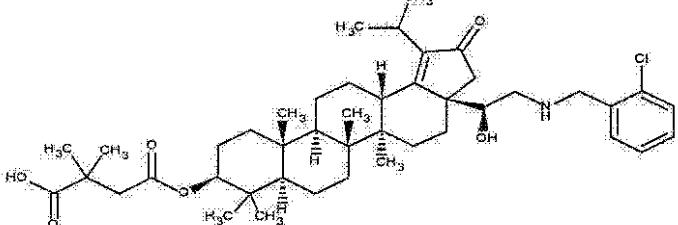
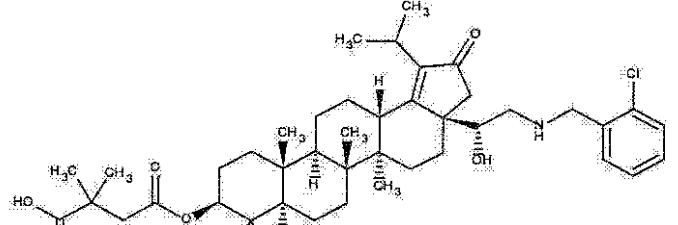
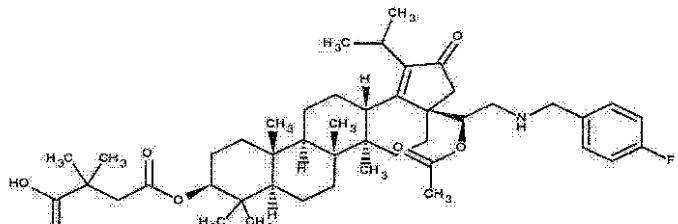
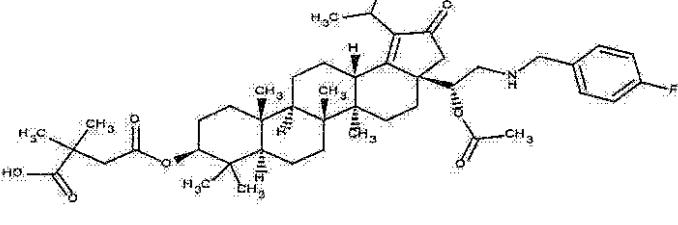
	<p>4-[(1S)-1-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R,17S,19R)-17-[(3-カルボキシ-3,3-ジメチルプロパノイル)オキシ]1,2,14,18,18-ペントメチル-7-オキソ-8-(プロパン-2-イル)ペンタシクロ[11.8.0.0{2,10}0^{\wedge}{5,9}.0^{\wedge}{14},19]ヘニコス-8-エン-5-イル]-2-[(4-クロロフェニル)メチル]2-(ジメチルアミノ)エチル]アミノ]エトキシ]-2,2-ジメチル-4-オキソブタン酸</p>
	<p>4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R,17S,19R)-5-(2-[(4-クロロフェニル)メチル]アミノ)エチル]-1,2,14,18,18-ペントメチル-7-オキソ-8-(プロパン-2-イル)ペンタシクロ[11.8.0.0{2,10}0^{\wedge}{5,9}.0^{\wedge}{14},19]ヘニコス-8-エン-17-イル]オキシ]-2,2-ジメチル-4-オキソブタン酸</p>
	<p>4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R,17S,19R)-5-[2-(ベンジルアミノ)エチル]-1,2,14,18,18-ペントメチル-7-オキソ-8-(プロパン-2-イル)ペンタシクロ[11.8.0.0{2,10}0^{\wedge}{5,9}.0^{\wedge}{14},19]ヘニコス-8-エン-17-イル]オキシ]-2,2-ジメチル-4-オキソブタン酸</p>
	<p>4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R,17S,19R)-5-(2-[(3-クロロフェニル)メチル]アミノ)エチル]-1,2,14,18,18-ペントメチル-7-オキソ-8-(プロパン-2-イル)ペンタシクロ[11.8.0.0{2,10}0^{\wedge}{5,9}.0^{\wedge}{14},19]ヘニコス-8-エン-17-イル]オキシ]-2,2-ジメチル-4-オキソブタン酸</p>

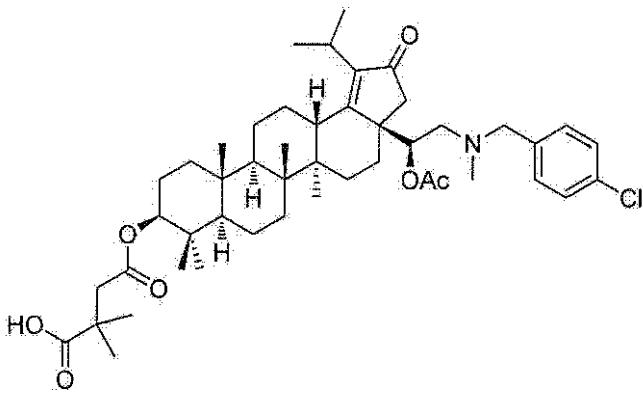
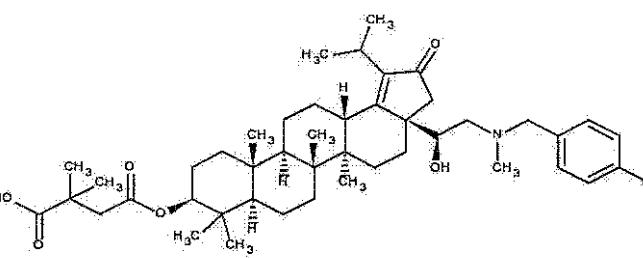
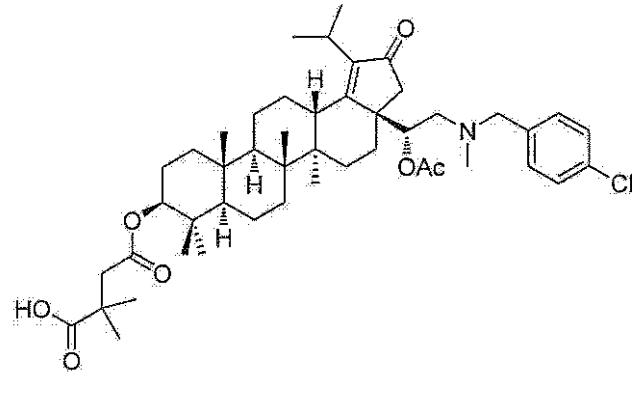
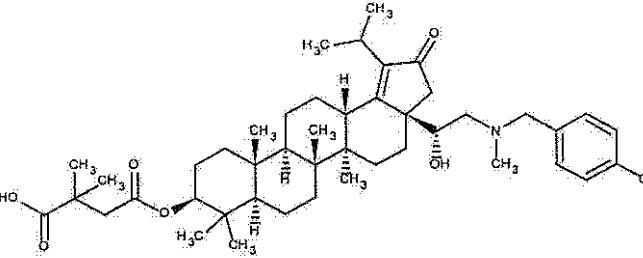
	<p>4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R, 17S,19R)-5-(2-[(3-クロロ-2- フルオロフェニル)メチル] アミノエチル]-1,2,14,18,18- ペンタメチル-7-オキソ -8-(プロパン-2-イル)ペント シクロ [11.8.0.0^{2,10}.0^{5,9}.0^{14}, 19]ヘニコス-8-エン-17-イ ル]オキシ}-2,2-ジメチル-4- オキソブタン酸</p>
	<p>4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R, 17S,19R)-5-(2-[(1-4-クロロ フェニル)シクロプロピル] アミノエチル]-1,2,14,18,18- ペンタメチル-7-オキソ -8-(プロパン-2-イル)ペント シクロ [11.8.0.0^{2,10}.0^{5,9}.0^{14}, 19]ヘニコス-8-エン-17-イ ル]オキシ}-2,2-ジメチル-4- オキソブタン酸</p>
	<p>4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R, 17S,19R)-5-(2-[(4-クロロフ ェニル)メチル][2-(ジメチル アミノ)エチル]アミノエチ ル]-1,2,14,18,18-ペンタメチ ル-7-オキソ-8-(プロパン-2- イル)ペントシクロ [11.8.0.0^{2,10}.0^{5,9}.0^{14}, 19]ヘニコス-8-エン-17-イ ル]オキシ}-2,2-ジメチル-4- オキソブタン酸</p>
	<p>4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R, 17S,19R)-5-(2-[(1-4-クロロ フェニル)シクロプロピ ル][2-(ジメチルアミノ)エチ ル]アミノエチ ル]-1,2,14,18,18-ペンタメチ ル-7-オキソ-8-(プロパン-2- イル)ペントシクロ [11.8.0.0^{2,10}.0^{5,9}.0^{14}, 19]ヘニコス-8-エン-17-イ ル]オキシ}-2,2-ジメチル-4- オキソブタン酸</p>

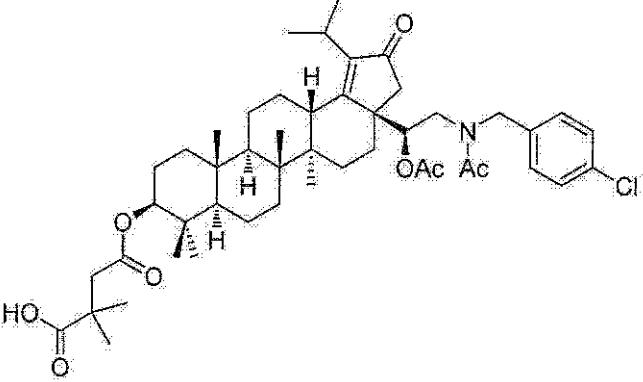
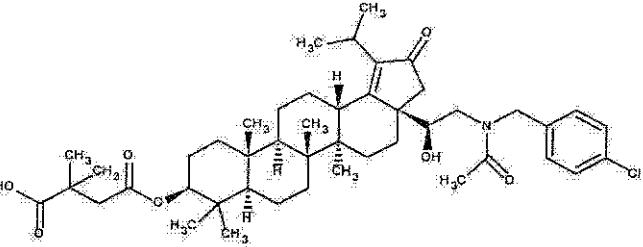
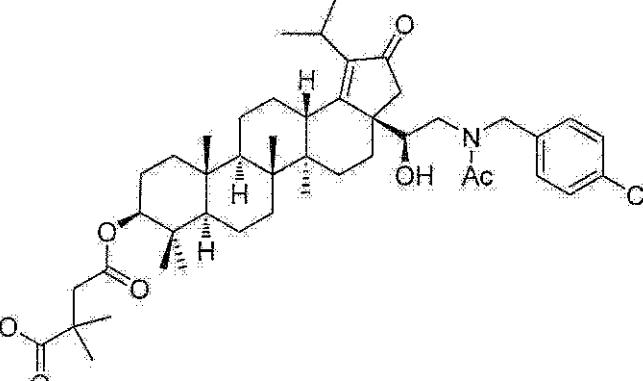
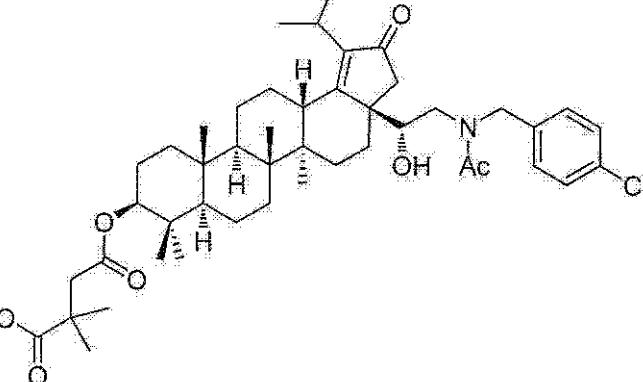
	<p>4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R, 17S,19R)-5-(2-[(4-クロロフ エニル)メチル](メチル)アミ ノ)エチル]-1,2,14,18,18-ペ ンタメチル-7-オキソ-8-(ブ ロパン-2-イル)ペンタシク ロ [11.8,0,0^{\wedge}(2,10),0^{\wedge}(5,9),0^{\wedge}(14 ,19)]ヘニコス-8-エン-17-イ ル]オキシ-2,2-ジメチル-4- オキソブタン酸</p>
	<p>4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R, 17S,19R)-5-(2-{N-[(4-クロロ フェニル)メチル]アセトアミ ド}エチル)-1,2,14,18,18-ペ ンタメチル-7-オキソ-8-(ブ ロパン-2-イル)ペンタシク ロ [11.8,0,0^{\wedge}(2,10),0^{\wedge}(5,9),0^{\wedge}(14 ,19)]ヘニコス-8-エン-17-イ ル]オキシ-2,2-ジメチル-4- オキソブタン酸</p>
	<p>4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R, 17S,19R)-5-[(1R)-2-[(4-クロ ロフェニル)メチル]アミ ノ]-1-ヒドロキシエチ ル]-1,2,14,18,18-ペンタメチ ル-7-オキソ-8-(ブロパン-2- イル)ペンタシクロ [11.8,0,0^{\wedge}(2,10),0^{\wedge}(5,9),0^{\wedge}(14 ,19)]ヘニコス-8-エン-17-イ ル]オキシ-2,2-ジメチル-4- オキソブタン酸</p>
	<p>4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R, 17S,19R)-5-[(1S)-2-[(4-クロ ロフェニル)メチル]アミ ノ]-1-ヒドロキシエチ ル]-1,2,14,18,18-ペンタメチ ル-7-オキソ-8-(ブロパン-2- イル)ペンタシクロ [11.8,0,0^{\wedge}(2,10),0^{\wedge}(5,9),0^{\wedge}(14 ,19)]ヘニコス-8-エン-17-イ ル]オキシ-2,2-ジメチル-4- オキソブタン酸</p>

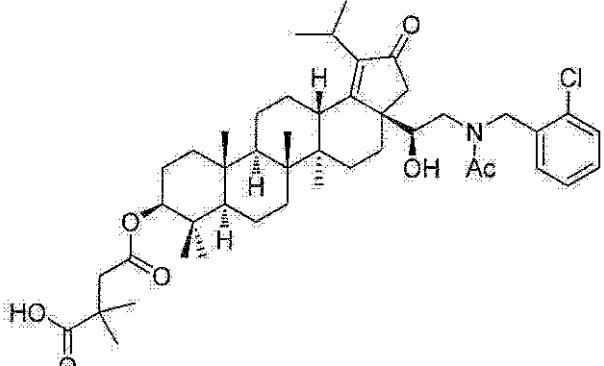
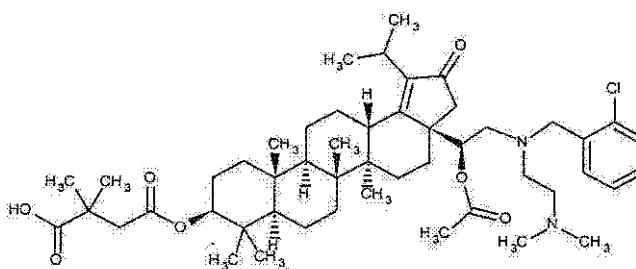
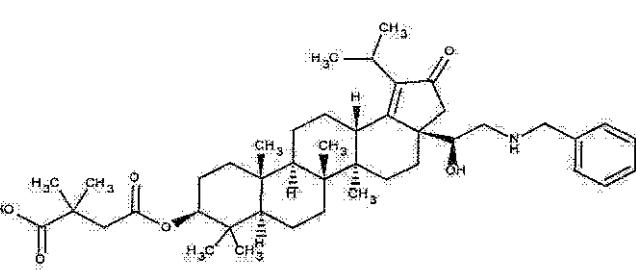
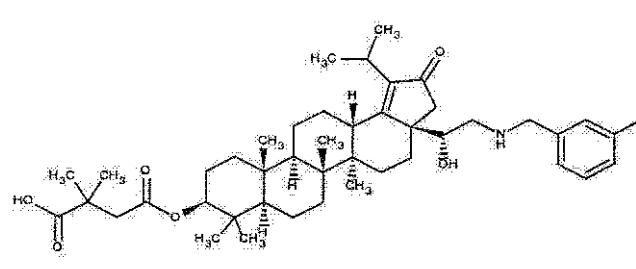
 <p>4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R, 17S,19R)-5-[(1S)-2-[(4-クロ ロフェニル)メチル]アミ ノ]-1-ヒドロキシエチ ル]-1,2,14,18,18-ペンタメチ ル-7-オキソ-8-(プロパン-2- イル)ペンタシクロ [11.8.0^A{2,10}.0^A{5,9}.0^A{14 ,19}]ヘニコス-8-エン-17-イ ル]オキシ-2,2-ジメチル-4- オキソブタン酸</p>
 <p>4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R, 17S,19R)-5-[(1R)-1-(アセチ ルオキシ)-2-[(4-クロロフェ ニル)メチル]アミノ]エチ ル]-1,2,14,18,18-ペンタメチ ル-7-オキソ-8-(プロパン-2- イル)ペンタシクロ [11.8.0^A{2,10}.0^A{5,9}.0^A{14 ,19}]ヘニコス-8-エン-17-イ ル]オキシ-2,2-ジメチル-4- オキソブタン酸</p>
 <p>4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R, 17S,19R)-5-[(1R)-2-[(4-クロ ロフェニル)メチル][2-(ジメ チルアミノ)エチル]アミ ノ]-1-ヒドロキシエチ ル]-1,2,14,18,18-ペンタメチ ル-7-オキソ-8-(プロパン-2- イル)ペンタシクロ [11.8.0^A{2,10}.0^A{5,9}.0^A{14 ,19}]ヘニコス-8-エン-17-イ ル]オキシ-2,2-ジメチル-4- オキソブタン酸</p>
 <p>4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R, 17S,19R)-5-[(1S)-2-[(4-クロ ロフェニル)メチル][2-(ジメ チルアミノ)エチル]アミ ノ]-1-ヒドロキシエチ ル]-1,2,14,18,18-ペンタメチ ル-7-オキソ-8-(プロパン-2- イル)ペンタシクロ [11.8.0^A{2,10}.0^A{5,9}.0^A{14 ,19}]ヘニコス-8-エン-17-イ ル]オキシ-2,2-ジメチル-4- オキソブタン酸</p>

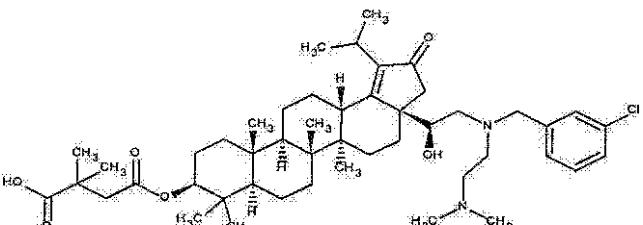
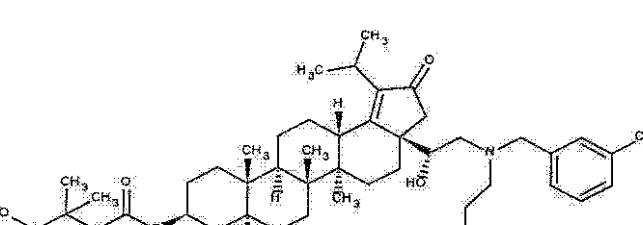
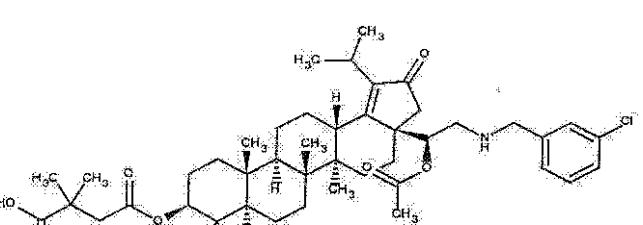
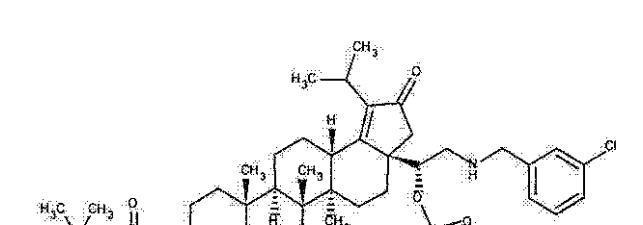
	4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R,17S,19R)-5-((1S)-1-(アセチルオキシ)エチル)-2-((4-クロロフェニル)メチル)[2-(ジメチルアミノ)エチル]アミノエチル]-1,2,14,18,18-ペンタメチル-7-オキソ-8-(プロパン-2-イル)ペントシクロ[11.8.0.0{2,10}.0^5{5,9}.0^4{14,19}]ヘニコス-8-エン-17-イル]オキシ]2,2-ジメチル-4-オキソブタン酸
	4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R,17S,19R)-5-((1R)-1-(アセチルオキシ)エチル)-2-((4-クロロフェニル)メチル)[2-(ジメチルアミノ)エチル]アミノエチル]-1,2,14,18,18-ペンタメチル-7-オキソ-8-(プロパン-2-イル)ペントシクロ[11.8.0.0{2,10}.0^5{5,9}.0^4{14,19}]ヘニコス-8-エン-17-イル]オキシ]2,2-ジメチル-4-オキソブタン酸
	5-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R,17S,19R)-5-((1R)-2-((4-クロロフェニル)メチル)[2-(ジメチルアミノ)エチル]アミノ-1-ヒドロキシエチル]-1,2,14,18,18-ペンタメチル-7-オキソ-8-(プロパン-2-イル)ペントシクロ[11.8.0.0{2,10}.0^5{5,9}.0^4{14,19}]ヘニコス-8-エン-17-イル]オキシ]3,3-ジメチル-5-オキソヘプタン酸
	5-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R,17S,19R)-5-((1S)-2-((4-クロロフェニル)メチル)[2-(ジメチルアミノ)エチル]アミノ-1-ヒドロキシエチル]-1,2,14,18,18-ペンタメチル-7-オキソ-8-(プロパン-2-イル)ペントシクロ[11.8.0.0{2,10}.0^5{5,9}.0^4{14,19}]ヘニコス-8-エン-17-イル]オキシ]3,3-ジメチル-5-オキソヘプタン酸

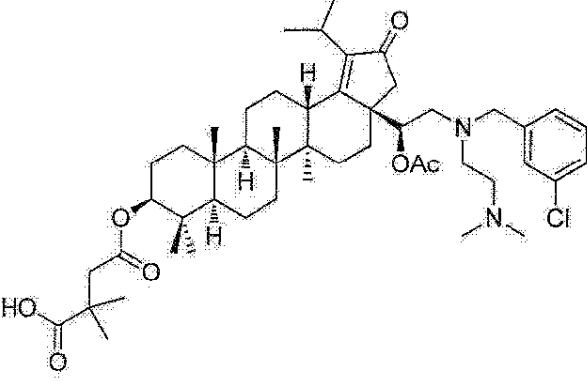
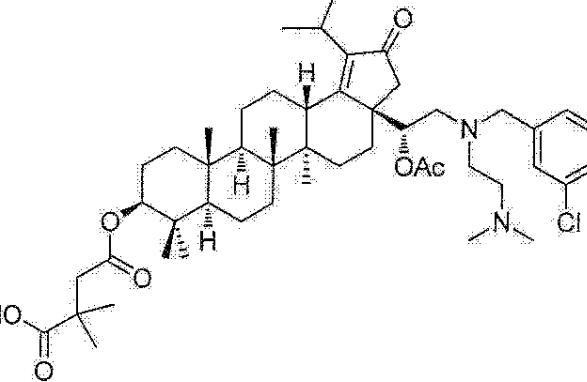
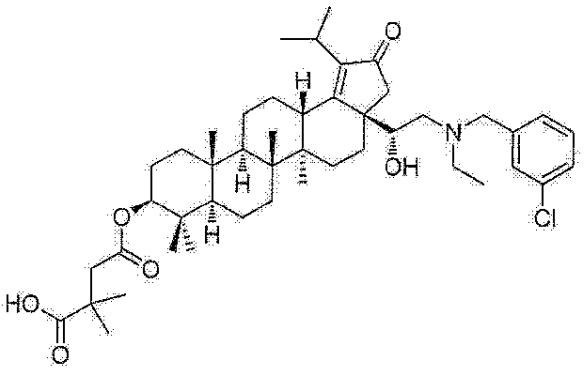
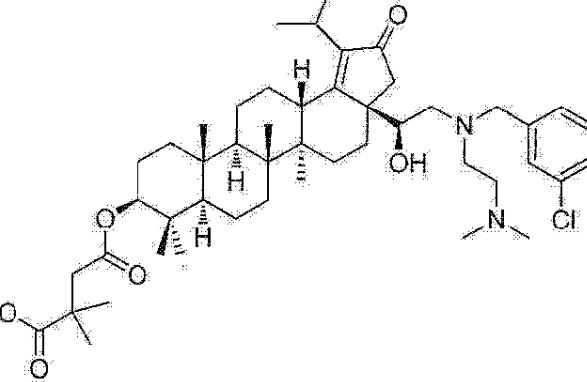
	4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R, 17S,19R)-5-[(1S)-2-[(2-クロ ロフェニル)メチル]アミ ノ]-1ヒドロキシエチ ル]-1,2,14,18,18-ペンタメチ ル-7-オキソ-8-(プロパン-2- イル)ペンタシクロ [11.8.0.0^{2,10},0^{4,5,9},0^{4,14 ,19}]-ヘニコス-8-エン-17-イ ル]オキシ-2,2-ジメチル-4- オキソブタン酸
	4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R, 17S,19R)-5-[(1R)-2-[(2-クロ ロフェニル)メチル]アミ ノ]-1ヒドロキシエチ ル]-1,2,14,18,18-ペンタメチ ル-7-オキソ-8-(プロパン-2- イル)ペンタシクロ [11.8.0.0^{2,10},0^{4,5,9},0^{4,14 ,19}]-ヘニコス-8-エン-17-イ ル]オキシ-2,2-ジメチル-4- オキソブタン酸
	4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R, 17S,19R)-5-[(1S)-1-(アセチ ルオキシ)-2-[(4-フルオロ フェニル)メチル]アミノ]エ チル]-1,2,14,18,18-ペンタメ チル-7-オキソ-8-(プロパン -2-イル)ペンタシクロ [11.8.0.0^{2,10},0^{4,5,9},0^{4,14 ,19}]-ヘニコス-8-エン-17-イ ル]オキシ-2,2-ジメチル-4- オキソブタン酸
	4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R, 17S,19R)-5-[(1R)-1-(アセチ ルオキシ)-2-[(4-フルオロ フェニル)メチル]アミノ]エ チル]-1,2,14,18,18-ペンタメ チル-7-オキソ-8-(プロパン -2-イル)ペンタシクロ [11.8.0.0^{2,10},0^{4,5,9},0^{4,14 ,19}]-ヘニコス-8-エン-17-イ ル]オキシ-2,2-ジメチル-4- オキソブタン酸

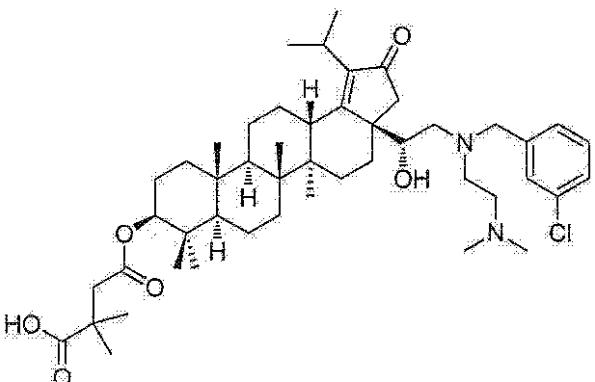
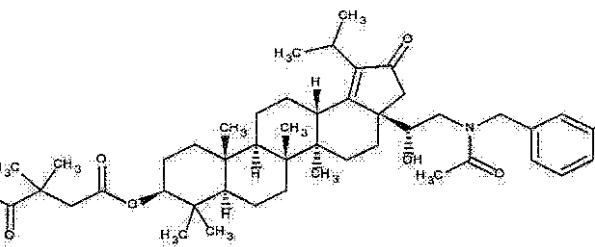
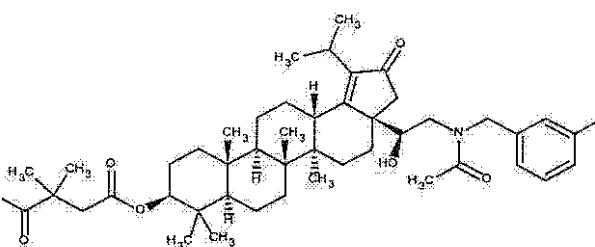
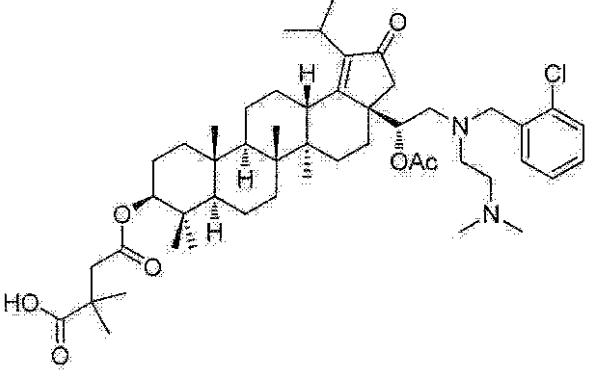
	4-(((3aR,5aR,5bR,7aR,9S,11aR,11bR,13aS)-3a-((S)-1-アセトキシ-2-((4-クロロベンジル)(メチル)アミノ)エチル)-1-イソプロピル-5a,5b,8,8,11a-ペントメチル-2-オキソ-3,3a,4,5,5a,5b,6,7,7a,8,9,10,11,11a,11b,12,13,13a-オクタデカヒドロ-2H-シクロペンタ[a]クリセン-9-イル)オキシ-2,2-ジメチル-4-オキソブタン酸
	4-[((1R,2R,5R,10S,13R,14R,17S,19R)-5-[(1S)-2-[(4-クロロフェニル)メチル](メチル)アミノ]-1-ヒドロキシエチル]-1,2,14,18,18-ペントメチル-7-オキソ-8-(プロパン-2-イル)ペントシクロ[11.8.0.0{2,10}.0{5,9}.0{14,19}]ヘニコス-8-エン-17-イル)オキシ]-2,2-ジメチル-4-オキソブタン酸
	4-(((3aR,5aR,5bR,7aR,9S,11aR,11bR,13aS)-3a-((R)-1-アセトキシ-2-((4-クロロベンジル)(メチル)アミノ)エチル)-1-イソプロピル-5a,5b,8,8,11a-ペントメチル-2-オキソ-3,3a,4,5,5a,5b,6,7,7a,8,9,10,11,11a,11b,12,13,13a-オクタデカヒドロ-2H-シクロペンタ[a]クリセン-9-イル)オキシ-2,2-ジメチル-4-オキソブタン酸
	4-[((1R,2R,5R,10S,13R,14R,17S,19R)-5-[(1R)-2-[(4-クロロフェニル)メチル](メチル)アミノ]-1-ヒドロキシエチル]-1,2,14,18,18-ペントメチル-7-オキソ-8-(プロパン-2-イル)ペントシクロ[11.8.0.0{2,10}.0{5,9}.0{14,19}]ヘニコス-8-エン-17-イル)オキシ]-2,2-ジメチル-4-オキソブタン酸

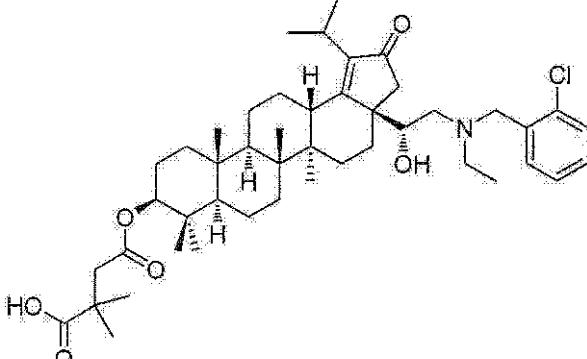
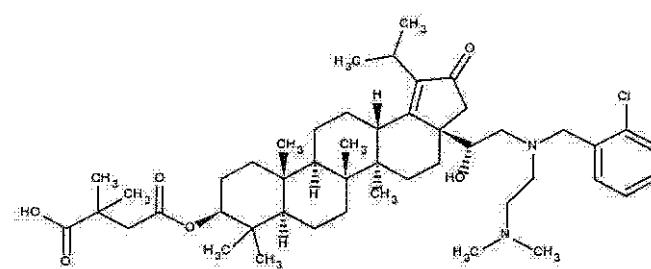
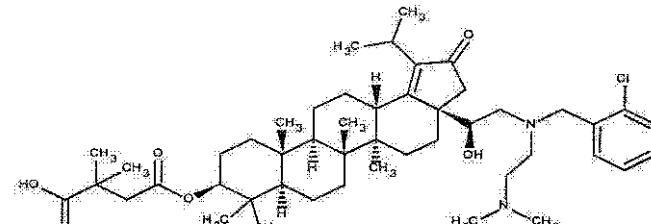
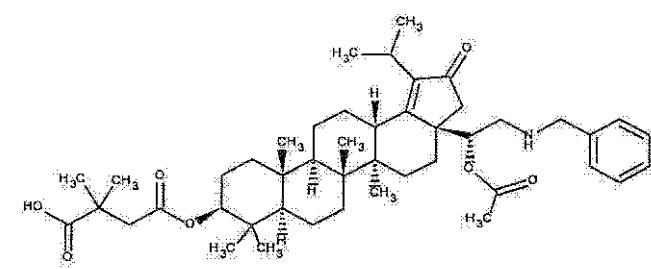
	4-(((3aR,5aR,5bR,7aR,9S,11aR,11bR,13aS)-3a-((S)-1-アセトキシ-2-(N-(4-クロロベンジル)アセトアミド)エチル)-1-イソプロピル-5a,5b,8,8,11a-ペンタメチル-2-オキソ-3,3a,4,5,5a,5b,6,7,7a,8,9,10,11,11a,11b,12,13,13a-オクタデカヒドロ-2H-シクロペニタ[a]クリセン-9-イル)オキシ)-2,2-ジメチル-4-オキソブタン酸
	4-[((1R,2R,5R,10S,13R,14R,17S,19R)-5-((1S)-2-(N-(4-クロロフェニル)メチル)アセトアミド)-1-ヒドロキシエチル)-1,2,14,18,18-ペンタメチル-7-オキソ-8-(プロパン-2-イル)ペンタシクロ-[11.8.0.0{2,10},0{5,9},0{14,19}]-ヘニコス-8-エン-17-イル)オキシ]-2,2-ジメチル-4-オキソブタン酸
	4-(((3aR,5aR,5bR,7aR,9S,11aR,11bR,13aS)-3a-((S)-2-(N-(4-クロロベンジル)アセトアミド)-1-ヒドロキシエチル)-1-イソプロピル-5a,5b,8,8,11a-ペンタメチル-2-オキソ-3,3a,4,5,5a,5b,6,7,7a,8,9,10,11,11a,11b,12,13,13a-オクタデカヒドロ-2H-シクロペニタ[a]クリセン-9-イル)オキシ)-2,2-ジメチル-4-オキソブタン酸
	4-(((3aR,5aR,5bR,7aR,9S,11aR,11bR,13aS)-3a-((R)-2-(N-(4-クロロベンジル)アセトアミド)-1-ヒドロキシエチル)-1-イソプロピル-5a,5b,8,8,11a-ペンタメチル-2-オキソ-3,3a,4,5,5a,5b,6,7,7a,8,9,10,11,11a,11b,12,13,13a-オクタデカヒドロ-2H-シクロペニタ[a]クリセン-9-イル)オキシ)-2,2-ジメチル-4-オキソブタン酸

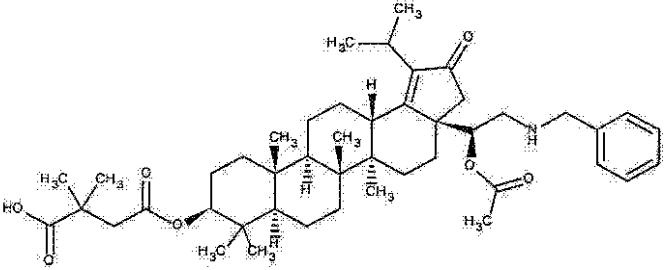
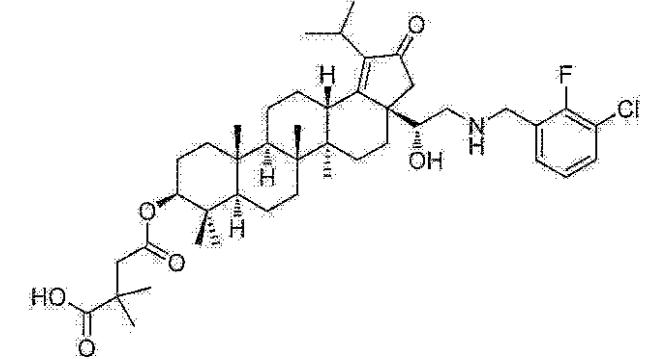
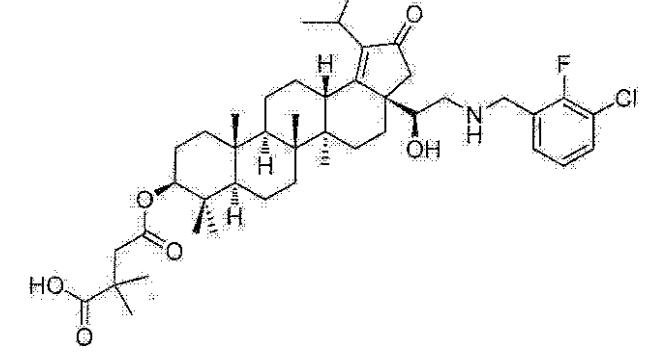
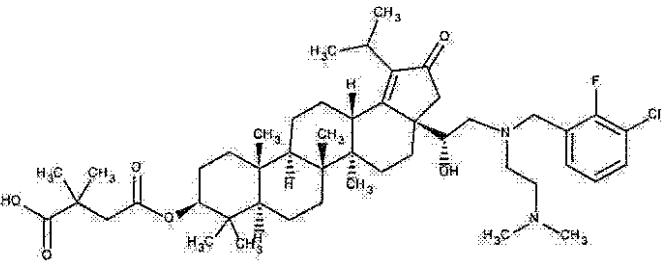
	<p>4-(((3aR,5aR,5bR,7aR,9S,11aR,11bR,13aS)-3a-((S)-2-(N-(2-クロロベンジル)アセトアミド)-1ヒドロキシエチル)-5a,5b,8,8,11a-ペンタメチル-2-オキソ-3,3a,4,5,5a,5b,6,7,7a,8,9,10,11,11a,11b,12,13,13a-オクタデカヒドロ-2H-シクロペニタ[a]クリセン-9-イル)オキシ)-2,2-ジメチル-4-オキソブタン酸</p>
	<p>4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R,17S,19R)-5-[(1S)-1-(アセチルオキシ)-2-[(2-クロロフェニル)メチル]-2-(ジメチルアミノ)エチル]-1,2,14,18,18-ペンタメチル-7-オキソ-8-(プロパン-2-イル)ペンタシクロ[11.8.0.0{2,10}.0{5,9}.0{14,19}]-ヘニコス-8-エン-17-イル]オキシ]-2,2-ジメチル-4-オキソブタン酸</p>
	<p>4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R,17S,19R)-5-[(1S)-2-[(3-クロロフェニル)メチル]アミノ]-1ヒドロキシエチル]-1,2,14,18,18-ペンタメチル-7-オキソ-8-(プロパン-2-イル)ペンタシクロ[11.8.0.0{2,10}.0{5,9}.0{14,19}]-ヘニコス-8-エン-17-イル]オキシ]-2,2-ジメチル-4-オキソブタン酸</p>
	<p>4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R,17S,19R)-5-[(1R)-2-[(3-クロロフェニル)メチル]アミノ]-1ヒドロキシエチル]-1,2,14,18,18-ペンタメチル-7-オキソ-8-(プロパン-2-イル)ペンタシクロ[11.8.0.0{2,10}.0{5,9}.0{14,19}]-ヘニコス-8-エン-17-イル]オキシ]-2,2-ジメチル-4-オキソブタン酸</p>

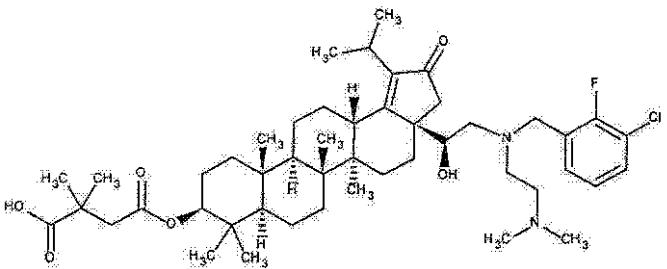
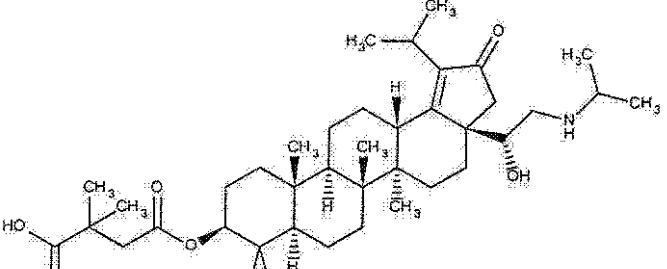
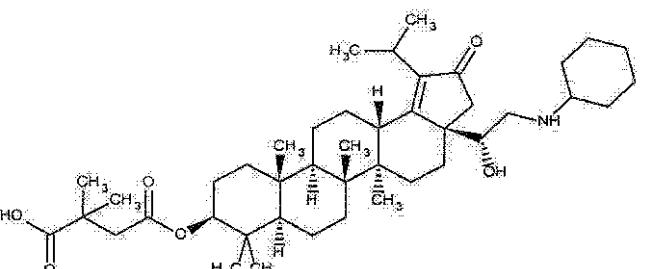
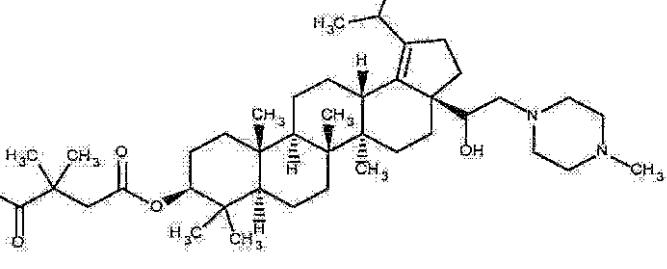
	4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R, 17S,19R)-5-[(1S)-2-[(3-クロ ロフェニル)メチル]2-(ジメ チルアミノ)エチル]アミ ノ]-1ヒドロキシエチ ル]-1,2,14,18,18-ペンタメチ ル-7-オキソ-8-(プロパン-2- イル)ペンタシクロ [11.8.0.0^{2,10}.0^{5,9}.0^{14 ,19}]ヘニコス-8-エン-17-イ ル]オキシ]-2,2-ジメチル-4- オキソブタン酸
	4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R, 17S,19R)-5-[(1R)-2-[(3-クロ ロフェニル)メチル]2-(ジメ チルアミノ)エチル]アミ ノ]-1ヒドロキシエチ ル]-1,2,14,18,18-ペンタメチ ル-7-オキソ-8-(プロパン-2- イル)ペンタシクロ [11.8.0.0^{2,10}.0^{5,9}.0^{14 ,19}]ヘニコス-8-エン-17-イ ル]オキシ]-2,2-ジメチル-4- オキソブタン酸
	4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R, 17S,19R)-5-[(1S)-1-(アセチ ルオキシ)-2-[(3-クロロフェ ニル)メチル]アミノ]エチ ル]-1,2,14,18,18-ペンタメチ ル-7-オキソ-8-(プロパン-2- イル)ペンタシクロ [11.8.0.0^{2,10}.0^{5,9}.0^{14 ,19}]ヘニコス-8-エン-17-イ ル]オキシ]-2,2-ジメチル-4- オキソブタン酸
	4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R, 17S,19R)-5-[(1R)-1-(アセチ ルオキシ)-2-[(3-クロロフェ ニル)メチル]アミノ]エチ ル]-1,2,14,18,18-ペンタメチ ル-7-オキソ-8-(プロパン-2- イル)ペンタシクロ [11.8.0.0^{2,10}.0^{5,9}.0^{14 ,19}]ヘニコス-8-エン-17-イ ル]オキシ]-2,2-ジメチル-4- オキソブタン酸

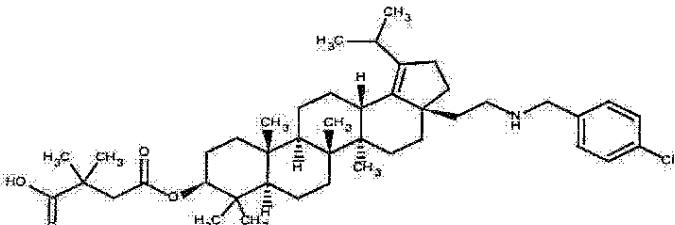
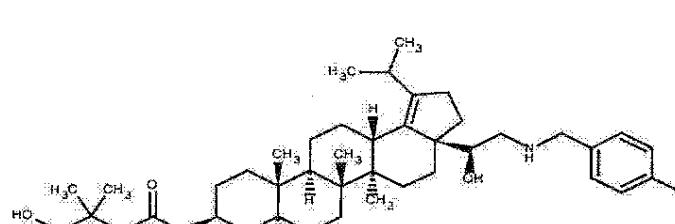
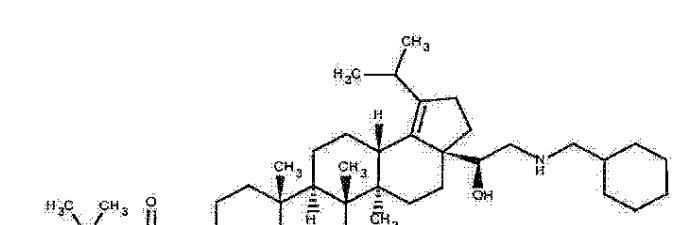
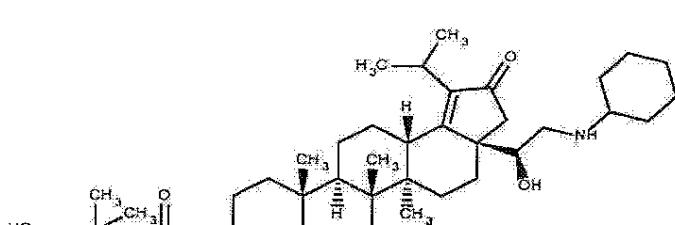
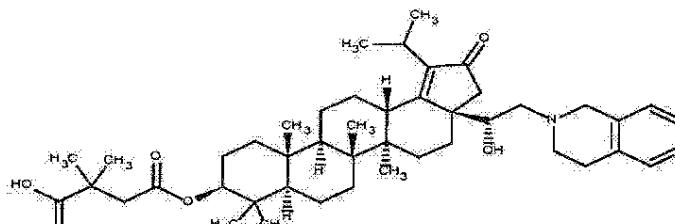
	4-(((3aR,5aR,5bR,7aR,9S,11aR,11bR,13aS)-3a-((S)-1-アセトキシ-2-(3-クロロベンジル)(2-(ジメチルアミノ)エチル)アミノ)エチル)-1-イソプロピル-5a,5b,8,8,11a-ペニタメチル-2-オキソ-3,3a,4,5,5a,5b,6,7,7a,8,9,10,11,11a,11b,12,13,13a-オクタデカヒドロ-2H-シクロペンタ[a]クリセン-9-イル)オキシ-2,2-ジメチル-4-オキソブタン酸
	4-(((3aR,5aR,5bR,7aR,9S,11aR,11bR,13aS)-3a-((R)-1-アセトキシ-2-(3-クロロベンジル)(2-(ジメチルアミノ)エチル)アミノ)エチル)-1-イソプロピル-5a,5b,8,8,11a-ペニタメチル-2-オキソ-3,3a,4,5,5a,5b,6,7,7a,8,9,10,11,11a,11b,12,13,13a-オクタデカヒドロ-2H-シクロペンタ[a]クリセン-9-イル)オキシ-2,2-ジメチル-4-オキソブタン酸
	4-(((3aR,5aR,5bR,7aR,9S,11aR,11bR,13aS)-3a-((R)-2-(3-クロロベンジル)(エチル)アミノ)ヒドロキシエチル)-1-イソプロピル-5a,5b,8,8,11a-ペニタメチル-2-オキソ-3,3a,4,5,5a,5b,6,7,7a,8,9,10,11,11a,11b,12,13,13a-オクタデカヒドロ-2H-シクロペンタ[a]クリセン-9-イル)オキシ-2,2-ジメチル-4-オキソブタン酸
	4-(((3aR,5aR,5bR,7aR,9S,11aR,11bR,13aS)-3a-((S)-2-(3-クロロベンジル)(2-(ジメチルアミノ)エチル)アミノ)ヒドロキシエチル)-1-イソプロピル-5a,5b,8,8,11a-ペニタメチル-2-オキソ-3,3a,4,5,5a,5b,6,7,7a,8,9,10,11,11a,11b,12,13,13a-オクタデカヒドロ-2H-シクロペンタ[a]クリ센-9-イル)オキシ-2,2-ジメチル-4-オキソブタン酸

	<p>4-(((3aR,5aR,5bR,7aR,9S,11aR,11bR,13aS)-3a-((R)-2-(3-クロロベンジル)(2-(ジメチルアミノ)エチル)アミノ)-1-ヒドロキシエチル)-1-イソプロピル-5a,5b,8,8,11a-ペントメチル-2-オキソ-3,3a,4,5,5a,5b,6,7,7a,8,9,10,11,11a,11b,12,13,13a-オクタデカヒドロ-2H-シクロペンタ[a]クリセン-9-イル)オキシ-2,2-ジメチル-4-オキソブタン酸</p>
	<p>4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R,17S,19R)-5-[(1R)-2-{N-[(3-クロロフェニル)メチル]アセトアミド}-1-ヒドロキシエチル]-1,2,14,18,18-ペントメチル-7-オキソ-8-(プロパン-2-イル)ペントシクロ[11.8.0.0{2,10}0{5,9}0{14,19}]ヘニコス-8-エン-17-イル]オキシ-2,2-ジメチル-4-オキソブタン酸</p>
	<p>4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R,17S,19R)-5-[(1S)-2-{N-[(3-クロロフェニル)メチル]アセトアミド}-1-ヒドロキシエチル]-1,2,14,18,18-ペントメチル-7-オキソ-8-(プロパン-2-イル)ペントシクロ[11.8.0.0{2,10}0{5,9}0{14,19}]ヘニコス-8-エン-17-イル]オキシ-2,2-ジメチル-4-オキソブタン酸</p>
	<p>4-(((3aR,5aR,5bR,7aR,9S,11aR,11bR,13aS)-3a-((R)-1-アセトキシ-2-(2-クロロベンジル)(2-(ジメチルアミノ)エチル)アミノ)エチル)-1-イソプロピル-5a,5b,8,8,11a-ペントメチル-2-オキソ-3,3a,4,5,5a,5b,6,7,7a,8,9,10,11,11a,11b,12,13,13a-オクタデカヒドロ-2H-シクロペンタ[a]クリセン-9-イル)オキシ-2,2-ジメチル-4-オキソブタン酸</p>

	4-(((3aR,5aR,5bR,7aR,9S,11aR,11bR,13aS)-3a-((R)-2-((2-クロロベンジル)(エチル)アミノ)-1-ヒドロキシエチル)-1-イソプロピル-5a,5b,8,8,11a-ペントメチル-2-オキソ-3,3a,4,5,5a,5b,6,7,7a,8,9,10,11,11a,11b,12,13,13a-オクタデカヒドロ-2H-シクロペンタ[a]クリセン-9-イル)オキシ)-2,2-ジメチル-4-オキソブタン酸
	4-[((1R,2R,5R,10S,13R,14R,17S,19R)-5-[(1R)-2-((2-クロロフェニル)メチル)[2-(ジメチルアミノ)エチル]アミノ]-1-ヒドロキシエチル]-1,2,14,18,18-ペントメチル-7-オキソ-8-(プロパン-2-イル)ペントシクロ[11.8.0.0{2,10}.0^5{9}.0^1{14},19]ヘニコス-8-エン-17-イル]オキシ)-2,2-ジメチル-4-オキソブタン酸
	4-[((1R,2R,5R,10S,13R,14R,17S,19R)-5-[(1S)-2-((2-クロロフェニル)メチル)[2-(ジメチルアミノ)エチル]アミノ]-1-ヒドロキシエチル]-1,2,14,18,18-ペントメチル-7-オキソ-8-(プロパン-2-イル)ペントシクロ[11.8.0.0{2,10}.0^5{9}.0^1{14},19]ヘニコス-8-エン-17-イル]オキシ)-2,2-ジメチル-4-オキソブタン酸
	4-[((1R,2R,5R,10S,13R,14R,17S,19R)-5-[(1R)-1-(アセチルオキシ)-2-(ベンジルアミノ)エチル]-1,2,14,18,18-ペントメチル-7-オキソ-8-(プロパン-2-イル)ペントシクロ[11.8.0.0{2,10}.0^5{9}.0^1{14},19]ヘニコス-8-エン-17-イル]オキシ)-2,2-ジメチル-4-オキソブタン酸

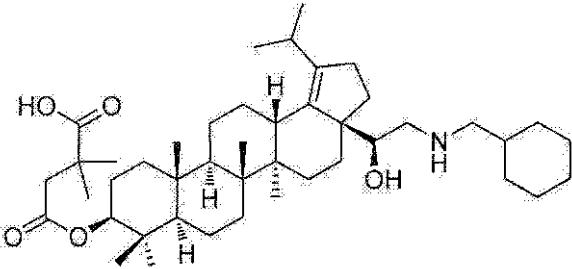
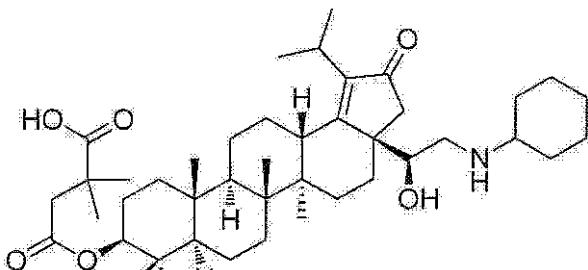
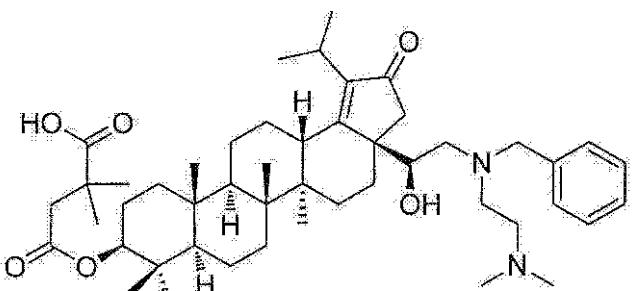
	<p>4-[[[(1R,2R,5R,10S,13R,14R, 17S,19R)-5-[(1S)-1-(アセチ ルオキシ)-2-(ベンジルアミ ノ)エチル]-1,2,14,18,18-ペ ンタメチル-7-オキソ-8-(ブ ロパン-2-イル)ペンタシク ロ [11.8.0.0^{\{2,10\}}.0^{\{5,9\}}.0^{\{14 ,19\}}]ヘニコス-8-エン-17-イ ル]オキシ]-2,2-ジメチル-4- オキソブタン酸</p>
	<p>4-(((3aR,5aR,5bR,7aR,9S,11 aR,11bR,13aS)-3a-((R)-2-((3 -クロロ-2-フルオロベンジ ル)アミノ)-1-ヒドロキシエ チル)-1-イソプロピル -5a,5b,8,8,11a-ペンタメチル -2-オキソ -3,3a,4,5,5a,5b,6,7,7a,8,9,10, 11,11a,11b,12,13,13a-オクタ デカヒドロ-2H-シクロペン タ[a]クリセン-9-イル)オキ シ)-2,2-ジメチル-4-オキソ ブタン酸</p>
	<p>4-(((3aR,5aR,5bR,7aR,9S,11 aR,11bR,13aS)-3a-((S)-2-((3 -クロロ-2-フルオロベンジ ル)アミノ)-1-ヒドロキシエ チル)-1-イソプロピル -5a,5b,8,8,11a-ペンタメチル -2-オキソ -3,3a,4,5,5a,5b,6,7,7a,8,9,10, 11,11a,11b,12,13,13a-オクタ デカヒドロ-2H-シクロペン タ[a]クリセン-9-イル)オキ シ)-2,2-ジメチル-4-オキソ ブタン酸</p>
	<p>4-[[[(1R,2R,5R,10S,13R,14R, 17S,19R)-5-[(1R)-2-((3-クロ ロ-2-フルオロフェニル)メ チル)-2-(ジメチルアミノ)エ チル]アミノ]-1-ヒドロキシ エチル]-1,2,14,18,18-ペ ンタメチル-7-オキソ-8-(ブ ロパン-2-イル)ペンタシクロ [11.8.0.0^{\{2,10\}}.0^{\{5,9\}}.0^{\{14 ,19\}}]ヘニコス-8-エン-17-イ ル]オキシ]-2,2-ジメチル-4- オキソブタン酸</p>

 <p>4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R, 17S,19R)-5-[(1S)-2-[(3-クロ ロ-2-フルオロフェニル)メ チル]2-(ジメチルアミノ)エ チル]アミノ]-1-ヒドロキシ エチル]-1,2,14,18,18-ペンタ メチル-7-オキソ-8-(プロパ ン-2-イル)ペントシクロ [11.8.0.0^{2,10}.0^{5,9}.0^{14 ,19}]-ヘニコス-8-エン-17-イ ル]オキシ]-2,2-ジメチル-4- オキソブタン酸</p>
 <p>4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R, 17S,19R)-5-[(1R)-1-ヒドロキ シ-2-(プロパン-2-イル)アミ ノ]エチル]-1,2,14,18,18-ペ ンタメチル-7-オキソ-8-(ブ ロパン-2-イル)ペントシクロ [11.8.0.0^{2,10}.0^{5,9}.0^{14 ,19}]-ヘニコス-8-エン-17-イ ル]オキシ]-2,2-ジメチル-4- オキソブタン酸</p>
 <p>4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R, 17S,19R)-5-[(1R)-2-(シクロ ヘキシリアミノ)-1-ヒドロキ シエチル]-1,2,14,18,18-ペ ンタメチル-7-オキソ-8-(ブ ロパン-2-イル)ペントシクロ [11.8.0.0^{2,10}.0^{5,9}.0^{14 ,19}]-ヘニコス-8-エン-17-イ ル]オキシ]-2,2-ジメチル-4- オキソブタン酸</p>
 <p>4-[(1R,2R,5S,10S,13R,14R, 17S,19R)-5-[(1-ヒドロキシ -2-(4-メチルピペラジン-1- イル)エチル]-1,2,14,18,18- ペンタメチル-8-(プロパン -2-イル)ペントシクロ [11.8.0.0^{2,10}.0^{5,9}.0^{14 ,19}]-ヘニコス-8-エン-17-イ ル]オキシ]-2,2-ジメチル-4- オキソブタン酸</p>

	4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R, 17S,19R)-5-{(4-クロロフ エニル)メチル}アミノ]エチ ル]-1,2,14,18,18-ペンタメチ ル-8-(プロパン-2-イル)ペ ンタシクロ [11.8.0.0^{2,10}.0^{5,9}.0^{14 ,19}]ヘニコス-8-エン-17-イ ル]オキシ-2,2-ジメチル-4- オキソブタン酸
	4-[(1R,2R,5S,10S,13R,14R, 17S,19R)-5-{(1S)-2-{(4-クロ ロフェニル)メチル}アミ ノ}-1-ヒドロキシエチ ル]-1,2,14,18,18-ペンタメチ ル-8-(プロパン-2-イル)ペ ンタシクロ [11.8.0.0^{2,10}.0^{5,9}.0^{14 ,19}]ヘニコス-8-エン-17-イ ル]オキシ-2,2-ジメチル-4- オキソブタン酸
	4-[(1R,2R,5S,10S,13R,14R, 17S,19R)-5-{(1S)-2-{(シクロ ヘキシルメチル)アミノ}-1- ヒドロキシエチ ル}-1,2,14,18,18-ペンタメチ ル-8-(プロパン-2-イル)ペ ンタシクロ [11.8.0.0^{2,10}.0^{5,9}.0^{14 ,19}]ヘニコス-8-エン-17-イ ル]オキシ-2,2-ジメチル-4- オキソブタン酸
	4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R, 17S,19R)-5-{(1S)-2-{(シクロ ヘキシルアミノ)-1-ヒドロキ シエチル}-1,2,14,18,18-ペ ンタメチル-7-オキソ-8-(ブ ロパン-2-イル)ペンタシク ロ [11.8.0.0^{2,10}.0^{5,9}.0^{14 ,19}]ヘニコス-8-エン-17-イ ル]オキシ-2,2-ジメチル-4- オキソブタン酸
	4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R, 17S,19R)-5-{(1R)-1-ヒドロキ シ-2-(1,2,3,4-テトラヒドロイ ソキノリン-2-イル)エチ ル}-1,2,14,18,18-ペンタメチ ル-7-オキソ-8-(プロパン-2- イル)ペンタシクロ [11.8.0.0^{2,10}.0^{5,9}.0^{14 ,19}]ヘニコス-8-エン-17-イ

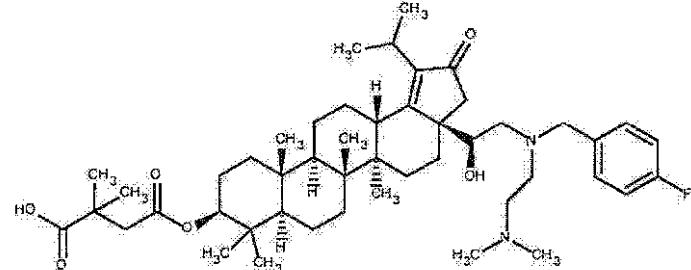
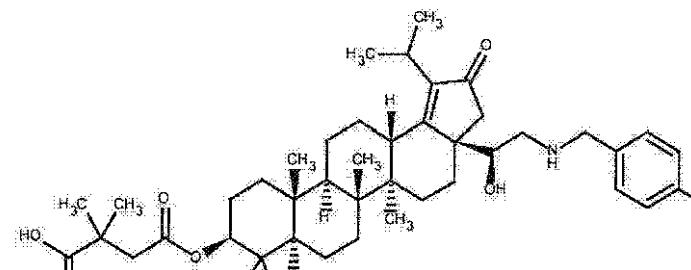
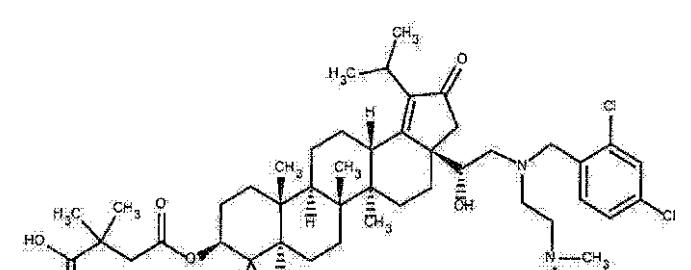
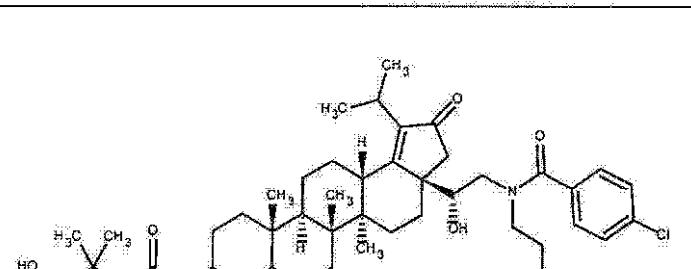
	ル]オキシ-2,2-ジメチル-4-オキソブタン酸
	4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R, 17S,19R)-5-[(1S)-1-ヒドロキ シ-2-(1,2,3,4-テトラヒドロイ ソキノリン-2-イル)エチ ル]-1,2,14,18,18-ペンタメチ ル-7-オキソ-8-(プロパン-2- イル)ペンタシクロ [11.8.0.0^2,10].0^5,9].0^14 [14,19]ヘニコス-8-エン-17-イ ル]オキシ-2,2-ジメチル-4- オキソブタン酸
	4-[(1R,2R,10S,13R,14R,17S ,19R)-5-[(5S)-3-[1-(5-クロロ ピリミジン-2-イル)シクロブ ロピル]-2-オキソ-1,3-オキ サゾリジン-5-イ ル]-1,2,14,18,18-ペンタメチ ル-7-オキソ-8-(プロパン-2- イル)ペンタシクロ [11.8.0.0^2,10].0^5,9].0^14 [14,19]ヘニコス-8-エン-17-イ ル]オキシ-2,2-ジメチル-4- オキソブタン酸
	4-[(1R,2R,10S,13R,14R,17S ,19R)-5-[(5R)-3-[1-(5-クロロ ピリミジン-2-イル)シクロブ ロピル]-2-オキソ-1,3-オキ サゾリジン-5-イ ル]-1,2,14,18,18-ペンタメチ ル-7-オキソ-8-(プロパン-2- イル)ペンタシクロ [11.8.0.0^2,10].0^5,9].0^14 [14,19]ヘニコス-8-エン-17-イ ル]オキシ-2,2-ジメチル-4- オキソブタン酸
	5-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R, 17S,19R)-5-[(1S)-2-[(4-クロ ロフェニル)メチル]アミ ノ]-1-ヒドロキシエチ ル]-1,2,14,18,18-ペンタメチ ル-7-オキソ-8-(プロパン-2- イル)ペンタシクロ [11.8.0.0^2,10].0^5,9].0^14 [14,19]ヘニコス-8-エン-17-イ

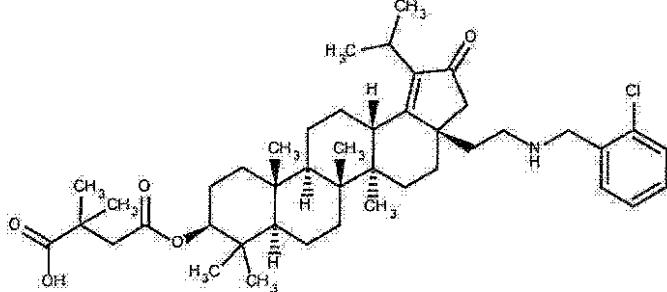
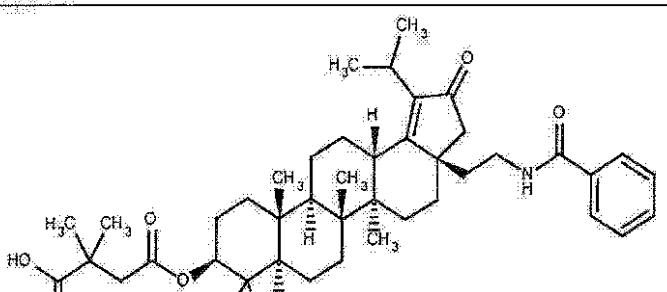
	ルオキシ)-3,3-ジメチル-5-オキソ pentan 酸
	4-(((3aR,5aR,5bR,7aR,9S,11aR,11bR,13aS)-3a-((R)-2-(3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)-1-ヒドロキシエチル)-1-イソプロピル-5a,5b,8,8,11a-ペントメチル-2-オキソ-3,3a,4,5,5a,5b,6,7,7a,8,9,10,11,11a,11b,12,13,13a-オクタデカヒドロ-2H-シクロペニタ[a]クリセン-9-イル)オキシ)-2,2-ジメチル-4-オキソブタン酸
	4-(((3aR,5aR,5bR,7aR,9S,11aR,11bR,13aS)-3a-((S)-2-(3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)-1-ヒドロキシエチル)-1-イソプロピル-5a,5b,8,8,11a-ペントメチル-2-オキソ-3,3a,4,5,5a,5b,6,7,7a,8,9,10,11,11a,11b,12,13,13a-オクタデカヒドロ-2H-シクロペニタ[a]クリセン-9-イル)オキシ)-2,2-ジメチル-4-オキソブタン酸
	4-(((3aS,5aR,5bR,7aR,9S,11aR,11bR,13aS)-3a-((R)-1-ヒドロキシ-2-(4-メチルピペラジン-1-イル)エチル)-1-イソプロピル-5a,5b,8,8,11a-ペントメチル-3,3a,4,5,5a,5b,6,7,7a,8,9,10,11,11a,11b,12,13,13a-オクタデカヒドロ-2H-シクロペニタ[a]クリセン-9-イル)オキシ)-2,2-ジメチル-4-オキソブタン酸

	4-(((3aS,5aR,5bR,7aR,9S,11aR,11bR,13aS)-3a-((S)-2-((シクロヘキシルメチル)アミノ)-1-ヒドロキシエチル)-1-イソプロピル-5a,5b,8,8,11a-ペンタメチル-3,3a,4,5,5a,5b,6,7,7a,8,9,10,11,11a,11b,12,13,13a-オクタデカヒドロ-2H-シクロペンタ[a]クリセン-9-イル)オキシ)-2,2-ジメチル-4-オキソブタン酸
	4-(((3aR,5aR,5bR,7aR,9S,11aR,11bR,13aS)-3a-((S)-2-((シクロヘキシルアミノ)-1-ヒドロキシエチル)-1-イソプロピル-5a,5b,8,8,11a-ペンタメチル-2-オキソ-3,3a,4,5,5a,5b,6,7,7a,8,9,10,11,11a,11b,12,13,13a-オクタデカヒドロ-2H-シクロペンタ[a]クリセン-9-イル)オキシ)-2,2-ジメチル-4-オキソブタン酸
	4-(((3aR,5aR,5bR,7aR,9S,11aR,11bR,13aS)-3a-((S)-2-(ベンジル(2-(ジメチルアミノ)エチル)アミノ)-1-ヒドロキシエチル)-1-イソプロピル-5a,5b,8,8,11a-ペンタメチル-2-オキソ-3,3a,4,5,5a,5b,6,7,7a,8,9,10,11,11a,11b,12,13,13a-オクタデカヒドロ-2H-シクロペンタ[a]クリセン-9-イル)オキシ)-2,2-ジメチル-4-オキソブタン酸

	4-[[[(1R,2R,5R,10S,13R,14R, 17S,19R)-5-[(1S)-1-(アセチ ルオキシ)-2-(ジメチル アミノ)エチル][(4-フルオロ フェニル)メチル]アミノ]エ チル]-1,2,14,18,18-ペンタメ チル-7-オキソ-8-(プロパン -2-イル)ペンタシクロ [11.8.0.0^{2,10}.0^{4}{5,9}.0^{4}{14 ,19}]ヘニコス-8-エン-17-イ ル]オキシ]-2,2-ジメチル-4- オキソブタン酸
	4-[[[(1R,2R,5R,10S,13R,14R, 17S,19R)-5-[(1R)-1-(アセチ ルオキシ)-2-(ジメチル アミノ)エチル][(4-フルオロ フェニル)メチル]アミノ]エ チル]-1,2,14,18,18-ペンタメ チル-7-オキソ-8-(プロパン -2-イル)ペンタシクロ [11.8.0.0^{2,10}.0^{4}{5,9}.0^{4}{14 ,19}]ヘニコス-8-エン-17-イ ル]オキシ]-2,2-ジメチル-4- オキソブタン酸
	5-[[[(1R,2R,5R,10S,13R,14R, 17S,19R)-5-[(1R)-2-[(4-クロ ロフェニル)メチル]アミ ノ]-1-ヒドロキシエチ ル]-1,2,14,18,18-ペンタメチ ル-7-オキソ-8-(プロパン-2- イル)ペンタシクロ [11.8.0.0^{2,10}.0^{4}{5,9}.0^{4}{14 ,19}]ヘニコス-8-エン-17-イ ル]オキシ]-3,3-ジメチル-5- オキソペնタन酸
	5-(((3aR,5aR,5bR,7aR,9S,11 aR,11bR,13aS)-3a-((S)-2-((4- クロロベンジル)アミノ)-1- ヒドロキシエチル)-1-イソ プロピル-5a,5b,8,8,11a-ペ ンタメチル-2-オキソ -3,3a,4,5,5a,5b,6,7,7a,8,9,10, 11,11a,11b,12,13,13a-オクタ デカヒドロ-2H-シクロペン タ[a]クリセン-9-イル)オキ シ)-3,3-ジメチル-5-オキソ ペնタन酸

	4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R, 17S,19R)-5-[(1S)-2-[(2,4-ジ クロロフェニル)メチ ル]2-(ジメチルアミノ)エチ ル]アミノ]-1-ヒドロキシエ チル]-1,2,14,18,18-ペンタメ チル-7-オキソ-8-(プロパン -2-イル)ペンタシクロ [11.8.0.0^A{2,10}.0^B{5,9}.0^C{14 ,19}]-ヘニコス-8-エン-17-イ ル]オキシ]-2,2-ジメチル-4- オキソブタン酸
	4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R, 17S,19R)-5-[(1R)-2-(ベンジ ル)2-(ジメチルアミノ)エチ ル]アミノ]-1-ヒドロキシエ チル]-1,2,14,18,18-ペンタメ チル-7-オキソ-8-(プロパン -2-イル)ペンタシクロ [11.8.0.0^A{2,10}.0^B{5,9}.0^C{14 ,19}]-ヘニコス-8-エン-17-イ ル]オキシ]-2,2-ジメチル-4- オキソブタン酸
	4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R, 17S,19R)-5-[(1R)-2-[(ジメ チルアミノ)エチル](4-フル オロフェニル)メチル]アミ ノ]-1-ヒドロキシエチ ル]-1,2,14,18,18-ペンタメ チル-7-オキソ-8-(プロパン-2- イル)ペンタシクロ [11.8.0.0^A{2,10}.0^B{5,9}.0^C{14 ,19}]-ヘニコス-8-エン-17-イ ル]オキシ]-2,2-ジメチル-4- オキソブタン酸
	4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R, 17S,19R)-5-[(1R)-2-[(4-フル オロフェニル)メチル]アミ ノ]-1-ヒドロキシエチ ル]-1,2,14,18,18-ペンタメ チル-7-オキソ-8-(プロパン-2- イル)ペンタシクロ [11.8.0.0^A{2,10}.0^B{5,9}.0^C{14 ,19}]-ヘニコス-8-エン-17-イ ル]オキシ]-2,2-ジメチル-4- オキソブタン酸

	4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R, 17S,19R)-5-[(1S)-2-[(2-(ジメチルアミノ)エチル]メチル]アミノ]-1-ヒドロキシエチル]-1,2,14,18,18-ペンタメチル-7-オキソ-8-(プロパン-2-イル)ペンタシクロ[11.8.0.0{2,10}.0{5,9}.0{14,19}]ヘニコス-8-エン-17-イル]オキシ]-2,2-ジメチル-4-オキソブタン酸
	4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R, 17S,19R)-5-[(1S)-2-[(4-フルオロフェニル)メチル]アミノ]-1-ヒドロキシエチル]-1,2,14,18,18-ペンタメチル-7-オキソ-8-(プロパン-2-イル)ペンタシクロ[11.8.0.0{2,10}.0{5,9}.0{14,19}]ヘニコス-8-エン-17-イル]オキシ]-2,2-ジメチル-4-オキソブタン酸
	4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R, 17S,19R)-5-[(1R)-2-[(2,4-ジクロロフェニル)メチル]アミノ]-1-ヒドロキシエチル]-1,2,14,18,18-ペンタメチル-7-オキソ-8-(プロパン-2-イル)ペンタシクロ[11.8.0.0{2,10}.0{5,9}.0{14,19}]ヘニコス-8-エン-17-イル]オキシ]-2,2-ジメチル-4-オキソブタン酸
	4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R, 17S,19R)-5-[(1R)-2-[1-(4-クロロフェニル)-N-[2-(ジメチルアミノ)エチル]ホルムアミド]-1-ヒドロキシエチル]-1,2,14,18,18-ペンタメチル-7-オキソ-8-(プロパン-2-イル)ペンタシクロ[11.8.0.0{2,10}.0{5,9}.0{14,19}]ヘニコス-8-エン-17-イル]オキシ]-2,2-ジメチル-4-オキソブタン酸

	4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R,17S,19R)-5-(2-(2-クロロエチルアミノ)エチル)-1,2,14,18,18-ペンタメチル-7-オキソ-8-(プロパン-2-イル)ペニタシクロ[11.8.0.0{2,10}.0{5,9}.0{14,19}]ヘニコス-8-エン-17-イル]オキシ-2,2ジメチル-4-オキソブタン酸
	2,2-ジメチル-4-オキソ-4-[(1R,2R,5R,10S,13R,14R,17S,19R)-1,2,14,18,18-ペンタメチル-7-オキソ-5-[2-(フェニルホルムアミド)エチル]-8-(プロパン-2-イル)ペニタシクロ[11.8.0.0{2,10}.0{5,9}.0{14,19}]ヘニコス-8-エン-17-イル]オキシブタン酸

**【請求項 5 2】**

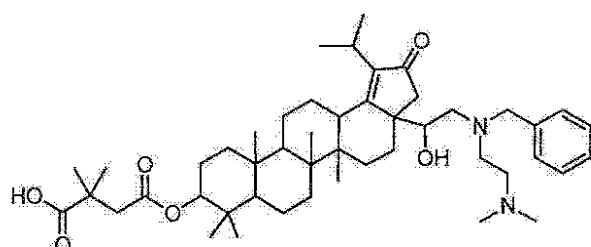
前記製薬上許容される塩が塩基塩である請求項1から51のうちのいずれか1項に記載の化合物。

**【請求項 5 3】**

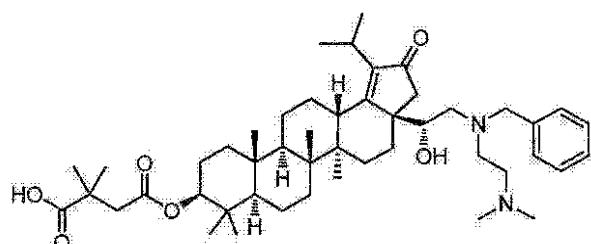
前記製薬上許容される塩がリジン塩である請求項52に記載の化合物。

**【請求項 5 4】**

下記構造を有する化合物。

**【化41】****【請求項 5 5】**

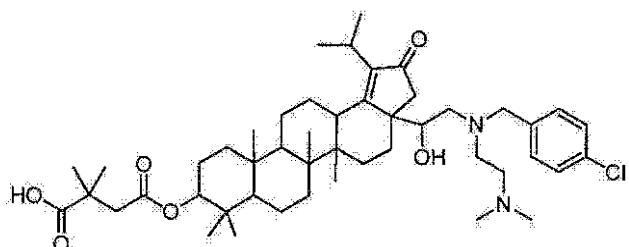
下記構造を有する化合物。

**【化42】**

## 【請求項 5 6】

下記構造を有する化合物。

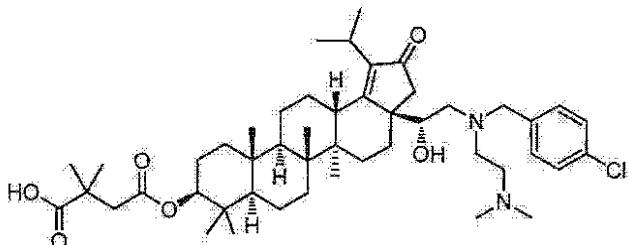
## 【化 4 3】



## 【請求項 5 7】

下記構造を有する化合物。

## 【化 4 4】



## 【請求項 5 8】

請求項1から57のうちのいずれか1項に記載の化合物または該化合物の製薬上許容される塩、および製薬上許容される賦形剤を含む医薬組成物。

## 【請求項 5 9】

前記化合物が非晶質形態で存在する請求項58に記載の組成物。

## 【請求項 6 0】

前記組成物が錠剤形態である請求項58に記載の組成物。

## 【請求項 6 1】

前記化合物が噴霧乾燥された分散剤として存在する請求項58に記載の組成物。

## 【請求項 6 2】

被験体に対して、請求項1から57のうちのいずれか1項に記載の化合物または該化合物の製薬上許容される塩を投与することを含む、被験体でのHIV感染の治療方法。

## 【請求項 6 3】

被験体に対して、請求項58に記載の医薬組成物を投与することを含む、被験体でのHIV感染の治療方法。

## 【請求項 6 4】

被験体に対して、請求項1から57のうちのいずれか1項に記載の化合物または該化合物の製薬上許容される塩を投与することを含む、HIV感染発症のリスクを有する被験体でのHIV感染の予防方法。

## 【請求項 6 5】

被験体に対して請求項58に記載の医薬組成物を投与することを含むHIV感染発症リスクを有する被験体でのHIV感染の予防方法。

## 【請求項 6 6】

HIVに対して活性な1以上の別の薬剤の投与をさらに含む請求項62から65のうちのいずれか1項に記載の方法。

## 【請求項 6 7】

前記HIVに対して活性な1以上の別の薬剤が、ジドブジン、ジダノシン、ラミブジン、ザルシタビン、アバカビル、スタブジン、アデフォビル、アデフォビルジピボキシル、ホジブジン、トドキシル、エムトリシタビン、アロブジン、アムドキソビル、エルブシタビン、ネビラピン、デラビルジン、エファビレンツ、ロビリド、イムノカル、オルチプラズ、

カプラビリン、レルシビリン、GSK2248761、TMC-278、TMC-125、エトラビリン、サキナビル、リトナビル、インジナビル、ネルフィナビル、アンプレナビル、ホスアンプレナビル、ブレカナビル、ダルナビル、アタザナビル、チプラナビル、パリナビル、ラシナビル、エンフビルチド、T-20、T-1249、PRO-542、PRO-140、TNX-355、BMS-806、BMS-663068およびBMS-626529、5-ヘリックス、ラルテグラビル、エルビテグラビル、GSK1349572、GSK1265744、ビクリビロック(Sch-C)、Sch-D、TAK779、マラビロク、TAK449、ジダノシン、テノホビル、ロピナビルおよびダルナビルからなる群から選択される請求項66に記載の方法。

#### 【請求項 6 8】

ヒトでのHIV感染の治療で使用される医薬の製造における請求項1から57のうちのいずれか1項に定義された化合物または塩の使用。

#### 【請求項 6 9】

治療法で使用される医薬の製造における請求項1から57のうちのいずれか1項に定義された化合物または塩の使用。

#### 【請求項 7 0】

前記被験体がヒトである請求項62から67のいずれか1項に記載の方法。

#### 【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 1 5

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 1 5】

からなる群から選択され、

Xは単環式もしくは二環式の(C<sub>5</sub>-C<sub>14</sub>)アリールであり、

Yは、単環式もしくは二環式の(C<sub>2</sub>-C<sub>9</sub>)複素環または単環式もしくは二環式の(C<sub>2</sub>-C<sub>9</sub>)ヘテロアリールから選択され、それらはそれぞれS、NまたはOから選択される1から3個のヘテロ原子を有してあり、

Zは単環式もしくは二環式の(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)シクロアルキルであり；

R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>がそれらがそれらが結合している窒素およびL<sub>2</sub>とともに、4から8員の複素環を形成しても良く、前記複素環は1から2個のR<sup>11</sup>基によって置換されても良く；

R<sup>4</sup>は、-Hおよび(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルからなる群から選択され；

R<sup>5</sup>は、-H、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、-R<sup>3</sup>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>および-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>OR<sup>7</sup>からなる群から選択され；

R<sup>6</sup>およびR<sup>6</sup>は独立に、-H、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)シクロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ、ハロアルキル、-Y、-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-C(O)OHおよび-C(O)NH<sub>2</sub>からなる群から選択され、前記R<sup>6</sup>およびR<sup>6</sup>基がそれらが結合している炭素とともに、3から8員のシクロアルキル環を形成しても良く、前記シクロアルキル環は1から3個のR<sup>11</sup>基によって置換されても良く；

R<sup>7</sup>およびR<sup>8</sup>は独立に、-H、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)シクロアルキル、-Q-アリール-(R<sup>4</sup>)<sub>n</sub>、-NR<sup>14</sup>R<sup>15</sup>、-C(O)CH<sub>3</sub>からなる群から選択され、R<sup>7</sup>およびR<sup>8</sup>が結合している窒素とともに、-NR<sup>5</sup>-、-O-、-S-、-S(O)-もしくは-SO<sub>2</sub>-から選択される1から3個のヘテロ原子を含む4から8員の複素環またはヘテロアリール環を形成しても良く、前記複素環またはヘテロアリール環は1から3個のR<sup>11</sup>基によって置換されても良く；

R<sup>9</sup>はハロであり；

R<sup>10</sup>は-N(R<sup>16</sup>)<sub>2</sub>であり；

R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>およびR<sup>13</sup>は独立に、オキソ、ヒドロキシル、ハロ、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ、-R<sup>6</sup>(R<sup>9</sup>)<sub>q</sub>、-OR<sup>6</sup>(R<sup>9</sup>)<sub>q</sub>、ニトロ、-SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、-C(O)R<sup>10</sup>、-R<sup>4</sup>YR<sup>6</sup>、-CO(O)R<sup>4</sup>、および-CO(O)R<sup>5</sup>からなる群から選択され、いずれか2個のR<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>またはR<sup>13</sup>基が一体となって3から8員のシクロアルキル、アリール、複素環またはヘテロアリール環を形成しても良く、前記複素環またはヘテロアリール環は-NR<sup>5</sup>-、-O-、-S-、-S(O)-もしくは-SO<sub>2</sub>-から選択される1から3個のヘテロ原子を含むことができ、前記シクロアルキル、アリール、複

素環またはヘテロアリール環は1から3個のR<sup>16</sup>基によって置換されていても良く；

R<sup>14</sup>およびR<sup>15</sup>は独立に、-H、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)シクロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ、-[C(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>]<sub>r</sub>、-O[C(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>]<sub>r</sub>、オキソ、ヒドロキシリル、ハロ、-C(O)R<sup>7</sup>、-R<sup>10</sup>および-CO(O)R<sup>2</sup>からなる群から選択され、R<sup>14</sup>およびR<sup>15</sup>がそれらが結合している炭素とともに、-NR<sup>5</sup>、-O-、-S-、-S(O)-もしくは-SO<sub>2</sub>-から選択される1から3個のヘテロ原子を含む3から8員のシクロアルキル環または4から8員の複素環を形成していても良く、前記シクロアルキル環または複素環は1から3個のR<sup>16</sup>基によって置換されていても良く；

R<sup>16</sup>は独立に、-H、ハロ、オキソ、ヒドロキシリル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ、(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)シクロアルキル、-R<sup>6</sup>(R<sup>9</sup>)<sub>q</sub>、-OR<sup>6</sup>(R<sup>9</sup>)<sub>q</sub>、-N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>-複素環、-C(O)OH、-C(O)NH<sub>2</sub>、-R<sup>5</sup>(R<sup>9</sup>)<sub>q</sub>、-OR<sup>5</sup>(R<sup>9</sup>)<sub>q</sub>、ニトロ、-SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、-C(O)R<sup>10</sup>および-CO(O)R<sup>4</sup>からなる群から選択され；

mおよびnは各場合で、独立に0、1、2、3または4であり；

pは独立に0、1、2、3または4であり；

rおよびqは各場合で独立に0、1、2、3または4である。

### 【手続補正3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 1 0 5

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 1 0 5】

からなる群から選択され、

Xは単環式もしくは二環式の(C<sub>5</sub>-C<sub>14</sub>)アリールであり、

Yは、単環式もしくは二環式の(C<sub>2</sub>-C<sub>9</sub>)複素環または単環式もしくは二環式の(C<sub>2</sub>-C<sub>9</sub>)ヘテロアリールから選択され、それらはそれぞれS、NまたはOから選択される1から3個のヘテロ原子を有してあり、

Zは単環式もしくは二環式の(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)シクロアルキルであり；

R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>がそれらがそれぞれ結合している窒素およびL<sub>2</sub>とともに、4から8員の複素環を形成していても良く、前記複素環は1から2個のR<sup>11</sup>基によって置換されていても良く；

R<sup>4</sup>は、-Hおよび(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルからなる群から選択され；

R<sup>5</sup>は、-H、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、-R<sup>3</sup>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>および-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>OR<sup>7</sup>からなる群から選択され；

R<sup>6</sup>およびR<sup>6</sup>は独立に、-H、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)シクロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ、ハロアルキル、-Y、-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-C(O)OHおよび-C(O)NH<sub>2</sub>からなる群から選択され、前記R<sup>6</sup>およびR<sup>6</sup>基がそれらが結合している炭素とともに、3から8員のシクロアルキル環を形成していても良く、前記シクロアルキル環は1から3個のR<sup>11</sup>基によって置換されていても良く；

R<sup>7</sup>およびR<sup>8</sup>は独立に、-H、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)シクロアルキル、-Q-アリール-(R<sup>4</sup>)<sub>n</sub>、-NR<sup>14</sup>R<sup>15</sup>、-C(O)CH<sub>3</sub>からなる群から選択され、R<sup>7</sup>およびR<sup>8</sup>がそれらが結合している窒素とともに、-NR<sup>5</sup>、-O-、-S-、-S(O)-もしくは-SO<sub>2</sub>-から選択される1から3個のヘテロ原子を含む4から8員の複素環またはヘテロアリール環を形成していても良く、前記複素環またはヘテロアリール環は1から3個のR<sup>11</sup>基によって置換されていても良く；

R<sup>9</sup>はハロであり；

R<sup>10</sup>は-N(R<sup>16</sup>)<sub>2</sub>であり；

R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>およびR<sup>13</sup>は独立に、オキソ、ヒドロキシリル、ハロ、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ、-R<sup>6</sup>(R<sup>9</sup>)<sub>q</sub>、-OR<sup>6</sup>(R<sup>9</sup>)<sub>q</sub>、ニトロ、-SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、-C(O)R<sup>10</sup>、-R<sup>4</sup>YR<sup>6</sup>、-CO(O)R<sup>4</sup>および-CO(O)R<sup>5</sup>からなる群から選択され、いずれか2個のR<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>またはR<sup>13</sup>基が一体となって3から8員のシクロアルキル、アリール、複素環またはヘテロアリール環を形成していて良く、前記複素環またはヘテロアリール環は-NR<sup>5</sup>、-O-、-S-、-S(O)-もしくは-SO<sub>2</sub>-から選択される1から3個のヘテロ原子を含むことができ、前記シクロアルキル、アリール、複素環またはヘテロアリール環は1から3個のR<sup>16</sup>基によって置換されていても良く；

$R^{14}$  および  $R^{15}$  は独立に、 -H、  $(C_1-C_6)$  アルキル、  $(C_3-C_8)$  シクロアルキル、  $(C_1-C_6)$  アルコキシ、  $-[C(R^6)_2]_r-$ 、  $-O[C(R^6)_2]_r-$ 、 オキソ、 ヒドロキシリル、 ハロ、  $-C(O)R^7$ 、  $-R^{10}$  および  $-CO(O)R^2$  からなる群から選択され、  $R^{14}$  および  $R^{15}$  がそれらが結合している炭素とともに、  $-NR^5-$ 、  $-O-$ 、  $-S-$ 、  $-S(O)-$  もしくは  $-SO_2-$  から選択される1から3個のヘテロ原子を含む3から8員のシクロアルキル環または4から8員の複素環を形成しても良く、 前記シクロアルキル環または複素環は1から3個の  $R^{16}$  基によって置換されていても良く；

$R^{16}$  は独立に、 -H、 ハロ、 オキソ、 ヒドロキシリル、  $(C_1-C_6)$  アルキル、  $(C_1-C_6)$  アルコキシ、  $(C_3-C_8)$  シクロアルキル、  $-R^6(R^9)_q$ 、  $-OR^6(R^9)_q$ 、  $-N(R^4)_2$ 、  $-(CH_2)_r$  複素環、  $-C(O)OH$ 、  $-C(O)NH_2$ 、  $-R^5(R^9)_q$ 、  $-OR^5(R^9)_q$ 、 ニトロ、  $-SO_2R^6$ 、  $-C(O)R^{10}$  および  $-CO(O)R^4$  からなる群から選択され；

$m$  および  $n$  は各場合で、 独立に0、 1、 2、 3または4であり；

$p$  は独立に0、 1、 2、 3または4であり；

$r$  および  $q$  は各場合で独立に0、 1、 2、 3または4である。

#### 【手続補正4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 1 1 0

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 1 1 0】

からなる群から選択され、

Xは単環式もしくは二環式の  $(C_5-C_{14})$  アリールであり、

Yは、 単環式もしくは二環式の  $(C_2-C_9)$  複素環または単環式もしくは二環式の  $(C_2-C_9)$  ヘテロアリールから選択され、 それらはそれぞれS、 NまたはOから選択される1から3個のヘテロ原子を有しております、

Zは単環式もしくは二環式の  $(C_3-C_8)$  シクロアルキルであり；

$R^4$  は、 -H および  $(C_1-C_6)$  アルキルからなる群から選択され；

$R^5$  は、  $(C_1-C_6)$  アルキル、  $-(CH_2)_rNR^7R^8$  および  $-(CH_2)_rOR^7$  からなる群から選択され；

$R^6$  および  $R^6$  は独立に、 -H、  $(C_1-C_6)$  アルキル、  $(C_3-C_8)$  シクロアルキル、  $(C_1-C_6)$  アルコキシ、 ハロアルキル、  $-(CH_2)_rNR^7R^8$ 、  $-C(O)OH$  および  $-C(O)NH_2$  からなる群から選択され、 前記  $R^6$  および  $R^6$  基がそれらが結合している炭素とともに、 3から8員のシクロアルキル環を形成しても良く、 前記シクロアルキル環は1から3個の  $R^{11}$  基によって置換されていても良く；

$R^7$  および  $R^8$  は独立に、 -H、  $(C_1-C_6)$  アルキル、  $(C_3-C_8)$  シクロアルキル、  $-NR^{14}R^{15}$  および  $-C(O)CH_3$  からなる群から選択され；

$R^9$  はハロであり；

$R^{10}$  は  $-N(R^{16})_2$  であり；

$R^{11}$ 、  $R^{12}$  および  $R^{13}$  は独立に、 オキソ、 ヒドロキシリル、 ハロ、  $(C_1-C_6)$  アルコキシ、  $-R^6(R^9)_q$ 、  $-OR^6(R^9)_q$ 、 ニトロ、  $-SO_2R^6$ 、  $(C_1-C_6)$  アルキル、  $-C(O)R^{10}$ 、  $-R^4YR^6$ 、  $-CO(O)R^4$  および  $-CO(O)R^5$  からなる群から選択され；

$R^{14}$  および  $R^{15}$  は独立に、 -H、  $(C_1-C_6)$  アルキル、  $(C_3-C_8)$  シクロアルキル、  $(C_1-C_6)$  アルコキシ、  $-[C(R^6)_2]_r-$ 、  $-O[C(R^6)_2]_r-$ 、 オキソ、 ヒドロキシリル、 ハロ、  $-C(O)R^7$ 、  $-R^{10}$  および  $-CO(O)R^2$  からなる群から選択され；

$R^{16}$  は独立に、 -H、 オキソ、 ハロ、 ヒドロキシリル、  $(C_1-C_6)$  アルキル、  $(C_1-C_6)$  アルコキシ、  $(C_3-C_8)$  シクロアルキル、  $-R^6(R^9)_q$ 、  $-OR^6(R^9)_q$ 、  $-N(R^4)_2$ 、  $-(CH_2)_r$  複素環、  $-C(O)OH$ 、  $-C(O)NH_2$ 、  $-R^5(R^9)_q$ 、  $-OR^5(R^9)_q$ 、 ニトロ、  $-SO_2R^6$ 、  $-C(O)R^{10}$  および  $-CO(O)R^4$  からなる群から選択され；

$m$  および  $n$  は各場合で、 独立に0、 1、 2、 3または4であり；

$p$  は独立に0、 1、 2、 3または4であり；

$r$  および  $q$  は各場合で独立に0、 1、 2、 3または4である。

#### 【手続補正5】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0197

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0197】

本発明のさらに別の実施形態において、式Iもしくは式IIの化合物またはその製薬上許容される塩および製薬上許容される賦形剤を含み、当該化合物が噴霧乾燥された(スプレードライ)分散剤として存在する医薬組成物が提供される。